



℗

# EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 90117567.9

2 Anmeldetag: 12.09.90

(1) Int. Cl.5: **C07D** 263/34, C07D 277/56, A01N 43/76, A01N 43/78

3 Priorität: 26.09.89 DE 3932052

(3) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 03.04.91 Patentblatt 91/14

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

(7) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft Carl-Bosch-Strasse 38 W-6700 Ludwigshafen(DE)

2 Erfinder: Ditrich, Klaus, Dr. Paray-le-Moniai-Strasse 12 W-6702 Bad Duerkheim(DE) Erfinder: Maywald, Volker, Dr. Berner Weg 24

W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Hamprecht, Gerhard, Dr.

**Rote-Turm-Strasse 28** W-6940 Weinheim(DE)

Erfinder: Harreus, Albrecht, Dr.

Teichgasse 13

W-6700 Ludwigshafen(DE) Erfinder: Wuerzer, Bruno, Dr.

Ruedigerstrasse 13 W-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergweg 58 W-6720 Speyer(DE)

- Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide.
- Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

Th

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; gegebenenfalls substituiertes C1-C6-Alkyl, Benzyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio; Alkoxy; Alkylthio; Halogenalkoxy; Halogenalkylthio; oder einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest;

R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR<sup>5</sup>;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R5 Wasserstoff; Cycloalkyl; gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Phenyl, Benzyl, Alkenyl, Cycloalkenyl oder Alkinyl;

einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations;

einen Rest -N = CR<sup>6</sup> R<sup>7</sup>;

R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> Wasserstoff; Alkyl; Cycloalkyl; Phenyl; Furyl oder zusammen eine Methylenkette mit 4 bis 7 Kettengliedem;

R3 Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl;

R4 Hydroxy; Alkoxy;

gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl oder Naphthyl;

einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; oder R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)<sub>n</sub>-Y<sub>p</sub>-(CH₂)<sub>q</sub>-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH₂)<sub>3</sub>-CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet, Verfahren zur Herstellung und herbizide Mittel, die die Verbindungen der Formeln Ia oder Ib als Wirkstoffe enthalten.

### **OXAZOL- BZW. THIAZOLCARBONSÄUREAMIDE**

Die vorliegende Erfindung betrifft Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

Ib

10

5

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C1-C6-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C3-C6-Cycloalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-

15 C4-Halogenalkylthio oder Cyano; Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

C3-C8-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl oder Halogen;

C2-C6-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C1-C3-Alkoxy und/oder ein 20 Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro; C2-C6-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C1-C3-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano

oder Nitro;

C1-C4-Alkoxy; C1-C4-Alkylthio; C1-C4-Halogenalkoxy; C1-C4-Halogenalkylthio; Phenoxy oder Phenytthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano

oder Nitro; ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxycarbonyl;

Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C6-Alkyl, C1-C6-Halogenalkyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Halogenalkoxy, C1-C6-Alkylthio, C1-C6-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano,

35 R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR<sup>5</sup>;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R5 Wasserstoff;

C1-C6-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkoxy, C2-C4-Alkoxy-C1-C4-alkoxy, Cyano, Trimethylsilyl, C1-C3-Alkylthio, C1-C3-Alky-40 lamino, C1-C3-Dialkylamino, C3-C7-Cycloalkylamino, C1-C3-Alkylsulfinyl, C1-C3-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C1-C<sub>3</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C1-C3-Alkyl, C1-C3-Alkoxy oder Halogen;

Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C3-Alkyl, C1-C3-Alkoxy, C1-C3-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C3-C8-Cycloalkyl;

Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C1-C4-Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und Cyano;

einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;

Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium;

einen Rest -N = CR6R7;

- R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup> Wasserstoff; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl; C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern;
  - $R^3$  Wasserstoff;  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder Di- $C_1$ - $C_3$ -Alkylamino;
- C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;
  - R<sup>4</sup> Hydroxy; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy;
  - $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino, Halogen,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio;
  - C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano;
  - $C_3$ - $C_6$ -Alkenyl oder  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$
- hio, Halogen, Cyano oder Nitro;
  - ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen;
- Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann, oder

- R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,
  - wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel und R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

Weiterhin betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sowie herbizide Mittel, welche mindestens eine Verbindung la oder Ib enthalten, in denen die Substituenten die vorstehend gegebene Bedeutung haben und X Schwefel bedeuten kann, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ und R² Wasserstoff bedeutet, oder wenn R¹ Thien-2-yl, YR⁵ Hydroxy, R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

Oxazol- und Thiazolcarbonsäuren bzw. deren Derivate sind bekannt (DE-A 22 54 944, Bull. Soc. Chim. Fr., 1989, 2152 sowie DE-A 22 21 647). Mögliche Anwendungen dieser Substanzen als herbizide Mittel sind nicht beschrieben.

- . Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, neue herbizid wirksame Verbindungen zu finden und zu synthetisieren.
- Demgemäß wurden die eingangs definierten Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb gefunden.

Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung gefunden und herbizide Mittel, welche Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb enthalten, in denen die Substituenten vorstehend gegebene Bedeutung haben.

- Die erfindungsgemäßen Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb sind auf verschiedenen Wegen herstellbar. Man erhält sie beispielsweise nach den folgenden Verfahren:
- 1. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₅-Alkyl bedeutet

55

$$- \frac{1}{R^{1}} \frac{1}{X} \frac{CO_{2}R^{5}}{CO_{2}R^{5}}$$

$$= \frac{1}{R^{1}} \frac{1}{X} \frac{CO_{2}R^{5}}{O}$$

$$= \frac{1}{R^{5}} = C_{1} - C_{6} - Alkyl$$

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb dadurch, daß man einen Diester der Formel II in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zum Monoester IIIa bzw. IIIb hydrolysiert und IIIa und IIIb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

Die einzelnen Reaktionsschritte A und B dieser Synthesesequenz können wie folgt durchgeführt werden:

### Reaktionsschritt A:

5

10

15

35

50

55

Die partielle Verseifung des Diesters II zum Monoester Va und Vb wird üblicherweise bei Temperaturen von -20 bis 60°C, vorzugswelse -10 bis 30°C, in einem inerten, mit Wasser mischbaren organischen Lösungsmittel in Gegenwart von 1,0 bis 1,2 mol-äq. einer Base durchgeführt.

Als Basen eignen sich insbesondere Hydroxyde von Alkalimetall-Kationen. Die Base wird im allgemeinen als 5 bis 20 %ige wäßrige Lösung zugesetzt.

Bevorzugte Lösungsmittel für diese Umsetzung sind beispielsweise Dioxan oder der der Esterkomponente in der Formel II entsprechende Alkohol.

Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch üblicherweise angesäuert, wobei sich das gewünschte Produkt als Feststoff oder als Öl abscheidet. Die Isolierung erfolgt in üblicher Weise durch Filtration bzw. Extraktion.

Das Gemisch der beiden isomeren Monoester Illa und Illb kann durch fraktionierte Kristallisation oder auf chromatographischem Wege getrennt werden oder es kann ohne Trennung weiter umgesetzt werden.

### Reaktionsschritt B:

Man erhält die Verbindungen la bzw. Ib aus den Monoestern IIIa und IIIb, in dem man IIIa und IIIb zunächst in an sich bekannter Weise in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäurefunktion überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

Aktivierte Formen der Carbonsäure sind neben Halogeniden wie insbesondere den Chloriden und den

Bromiden beispielsweise auch Imidazolide. Im allgemeinen werden die Halogenide bevorzugt.

Man erhält sie durch Umsetzung der Carbonsäuren IIIa und IIIb mit einem Halogenierungsmittel wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosphoroxychlorid bzw. -bromid, Phosphortri- und -pentachlorid bzw. -bromid, Phosgen sowie elementarem Chlor und Brom.

Das Halogenierungsmittel wird in 1 bis 5 mol-äq., vorzugsweise 1 bis 2 mol.äq., eingesetzt.

Die Umsetzung verläuft bei Temperaturen von 0°C bis zum Siedepunkt des Halogenierungsmittels bzw. sofem man in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels arbeitet, auch dessen Siedepunkt, vorzugsweise 20 bis 120°C.

Als Lösungsmittel eignen sich beispielsweise Kohlenwasserstoffe und Halogenkohlenwasserstoffe wie Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol, 1,2-Dichlorbenzol, Benzol, Toluol and Xylol.

Üblicherweise werden die aktivierten Carbonsäurederivate isoliert, beispielsweise durch abdestillieren des Halogenierungsmittels und sofern vorhanden des Lösungsmittels und erst anschließend mit den Aminen IV umgesetzt.

In diesem Fall wird die Amidierung bei Temperaturen von -20 bis 100°C, vorzugsweise -10 bis 20°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Für diese Umsetzung eignen sich insbesondere Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Ether wie Diethylether und tert.-Butylmethylether als Lösungsmittel.

Da bei der Amidierung von Säurehalogeniden Halogenwasserstoff gebildet wird, empfiehlt es sich, das Amin IV in 2 bis 5 mol.-äq. Überschuß, vorzugsweise 2 bis 3 mol.-äq. zuzusetzen. Sofern das Amin in äquimolaren Mengen (1 bis 1,2 mol-äq.) eingesetzt wird, sollte zum Binden des Halogenwasserstoffs eine Base, insbesondere ein tertiäres Amin wie Triethylamin oder Pyridin zugegeben werden.

Sofern man von einem Gemisch der Monoester Illa und Illb ausgeht erhält man bei der Umsetzung ein Gemisch aus den Isomeren Carbonsäureamiden la und Ib. Dieses Gemisch kann auf herkömmliche Weise, beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation oder Chromatographie in die Einzelkomponenten aufgetrennt werden.

Die für diese Synthesesequenz benötigten Edukte II sind bekannt (Bull. Soc. Chim. Fr. 1974, 2079) oder nach bekannten Methoden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93) zugänglich.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen X Schwefel und R2 CO2H bedeutet

5

30

35

50

....

Ü KY

Man erhält diese Thiazolcarbonsäureamide la und Ib besonders vorteilhaft, indem man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formel IV zu den Isomeren la und Ib umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

Die Umsetzung wird üblicherweise bei Temperaturen von -10 bis 150°C, vorzugsweise 20 bis 120°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Insbesondere kommen als Lösungsmittel Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylen-chlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamld, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromate, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chlnolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon oder entsprechende Gemische zur

### Anwendung.

10

15

Das Amin IV wird im allgemeinen in äugimolaren Mengen oder im Überschuß, vorzugsweise in Mengen von 1,0 bis 5,0 mol-äq. bezogen auf V eingesetzt.

Die für dieses Verfahren benötigten Dicarbonsäureanhydride sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; CS-A-195 369; CS-A-195 370).

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet

$$R^{1} = R^{2} + R^{2}$$

$$R^{2} = R^{2} + R^{2}$$

$$R^{2$$

Man erhält diese isomeren Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide, indem man eine Carbonsäure Illc bzw. Illd gemäß den unter 1 B geschilderten Bedingungen aktiviert und amidiert und die so erhaltenen Amide Vla und Vlb anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines Carboxylierungs-oder Formylierungsreagens' umsetzt.

Der Reaktionsschritt A. dieser Synthesesequenz wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt B beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

### Reaktionsschritt B.

40

50

Die Carboxylierung bzw. Formylierung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide VIa bzw. VIb erfolgt in der Regel bei Temperaturen von 0 bis -100°C, vorzugsweise -50 bis -80°C in einem aprotisch polaren inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base unter Ausschluß von Feuchtigkeit.

Bevorzugtes Carboxylierungsreagens ist gasförmiges oder festes Kohlendioxid, als Formylierungsreagens dient insbesondere Dimethylformamid und N-Formylmorpholin.

Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan.

Als Basen finden bevorzugt Organometallverbindungen Methyllithium, n-Butyllithium, s-Butyllithium, t-Butyllithium oder Phenyllithium Verwendung.

Die Umsetzung wird üblicherweise so durchgeführt, daß zunächst eine Lösung des Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids VIa bzw. VIb mit bis 3 mol-äq der gelösten Base versetzt wird, wobei ein am Heterocyclus metalliertes Derivat entsteht, welches bei der anschließenden Zugabe des elektrophilen Carboxylierungs- bzw. Formylierungsreagens' zum gewünschten Produkt la bzw. Ib abreagiert.

Sofem R³ Wasserstoff bedeutet werden entsprechend mehr mol-äq. der Base benötigt, da in diesem Fall zunächst der Amid-Stickstoff deprotoniert wird. Vorzugsweise verwendet man daher bei der Umetzung von Carbonsäureamiden VIa bzw. VIb, in denen R³ Wasserstoff bedeutet 2 bis 2,5 mol-äq der Base.

Verbindungen VIa bzw. VIb, in denen R¹ Wasserstoff bedeutet werden bei der Umsetzung mit der Base zunächst in 2-Position des Heterocyclus' metalliert.

Um in diesem Fall den Carboxyl- bzw. Formylrest in Nachbarstellung zur Amidgruppe einzuführen ist es notwendig, von Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamiden VIa bis VIb auszugehen, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la bzw. Ib in denen R¹ Wasserstoff und R³ nicht Wasserstoff bedeutet erhält man aus den nach dem vorstehenden Verfahren zugänglichen Verbindungen, in denen R¹ und R³ Wasserstoff bedeutet, in an sich bekannter Weise durch nachträgliche Alkylierung oder Cycloalkylierung.

Die für das vorstehende Verfahren benötigten Carbonsäuren IIIc und IIId sind literaturbekannt Beilstein, (Band 27, 1.-5. Erg.Werte) oder sie können nach bekannten Methoden, beispielsweise durch Oxidation der entsprechenden Alkohole oder Aldehyde oder durch Hydrolyse der entsprechenden Nitrile hergestellt werden (J.V. Metzger in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 34, Part 1, Thiazol and its Derivatives", Arnold Weissberger and E.D. Ward C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons, S. 519 ff, I.J. Turchi in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 45, Oxazoles", Arnold Weissberger and E.D. Ward, C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons).

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R<sup>2</sup> Carboxyl bedeutet.

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb beispielsweise dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäureamid la bzw. lb, in dem R² für CO₂R⁵ und R⁵ für C₁-C6-Alkyl steht in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert. Die Umsetzung ist im folgenden Schema lediglich für die Carbonsäureamide la gezeigt. Sofern man von den entsprechenden Carbonsäureamiden lb ausgeht verläuft sie analog.

Diese Synthese wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt A beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R2 COYR5 bedeutet:

Man erhält diese Carbonsäureamide la und lb, in dem man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb (R² = CO₂H) aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII umsetzt.

45

50

10

20

25

35

15

20

25

35

40

45

50

55

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -20°C bis zur Rückflußtemperatur des Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei 0 bis 60°C durchgeführt werden.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten z.B. Benzol, Toluol oder Xylol; oder entsprechende Gemische.

Als wasserentziehende Mittel kommen Dicyclohexylcarbodiimid oder Propanphosphonsäureanhydrid in Betracht.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 0,5:1 bis 2:1 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu Alkohol oder Thiol und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu wasserentziehendem Mittel.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Ethern wie Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan; mit Propanphosphonsäureanhydrid als wasserentziehendem Mittel bei 20 bis 60°C.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in der R² eine 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl-gruppe bedeutet

Man erhält diese Verbindungen dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäurederivat la bzw. lb, in dem R² eine Gruppe CO<sub>2</sub>R´ oder COOH und R´ C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise mit einem Aminoalkohol der Formel VIII umsetzt.

5 
$$R^3$$
 oder  $R^3$   $R^4$   $R^4$   $R^3$   $R^4$   $R^3$   $R^4$   $R^3$   $R^4$   $R^3$   $R^4$   $R^4$   $R^3$   $R^4$   $R^4$ 

Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man die Verbindungen bei 0 bis 180°C, vorzugsweise bei Rückflußtemperatur des verwendeten Gemisches mit einem Aminoalkohol VIII, gegebenenfalls in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels umsetzt. Ester oder Carbonsäure la bzw. Ib und Aminoalkohol VIII werden dabei im Verhältnis 1:1 bis 1:2,5, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,5 eingesetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man zweckmäßigerweise Halogenkohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol, Ether, z.B. Methyl-tert.-butylether, 1,2-Dimethoxyethan, Diethylenglykol-dimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Ethylenglykol, dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrollidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolin-2-on oder Aromaten, z.B. Benzol, Toluol und Xylol. Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5,0 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Die Umsetzung ist im allgemeinen nach 14 Stunden beendet; die Carbonsäureamide la und Ib werden dann gegebenenfalls durch Zugabe von Wasser ausgefällt, abgesaugt oder mit einem organischen Lösungsmittel extrahiert und mit üblichen Standardmethoden wie Umkristallisation oder Chromatographie gereinigt.

Man erhält die Verbindungen der Formel VIa, in denen R¹ einen Alkohol oder Thiolrest -ZR³ bedeutet, in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamids VIa (DE 22 41 035) in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol.

40

45

Hal in Formel VIa bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIa, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel Vla´ bedeutet C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methyl-ethoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können, insbesondere 2,4-Dichlorphenoxy, 2,4-Difluorphenoxy, 2,4,6-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, 2-Chlor-4-Trifluorphenoxy, 3-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, 2-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, 3-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-

Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH<sub>2</sub>, LIH und KO-t.-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamid Vla und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on oder Ethern wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Ba als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel IIIa können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (DE-A 22 41 035).

Die zum Einsatz kommenden Alkohole oder Thiole sind in vielen Fällen kommerziell erhältlich oder können in an sich bekannter Weise hergestellt werden.

Des weiteren erhält man die Verbindungen der Formel VIb in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-5-carbonsäureamids IIIb in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol gemäß Schema 2:

30

35

Hal in Formel VIb bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIb, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel VIb bedeutet C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können;

insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methyl-ethoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können; insbesondere 2,4-Dichlorphenoxy, 2,4-Difluorphenoxy, 2,4-C-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, 2-Chlor-4-Trifluorphenoxy, 3-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, 2-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, 3-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH<sub>2</sub>, LiH und KO-t-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-

4-carbonsäureamid VIb und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3- Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on oder Ethem wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Butylat als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel VIb können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (US-A-4 001 421).

Verbindungen der Formel IVb können gewonnen werden, indem man Dicarbonsäureester der Formel XI in an sich bekannter Weise mit Arninen umsetzt und die resultierenden Arnide IXb gemäß Schema G verseift:

Zweckmäßigerweise geht man dabei so vor, daß man den Diester II in einem inerten organischen Lösungsmittel löst und mit einem Amin umsetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man für diese Umsetzungen Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol oder Mesitylen; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Das molare Verhältnis, in dem Diester II und Arnin eingesetzt werden, beträgt 1:1 bis 1:2, vorzugsweise 1:1 bis 1:1.2.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Alkoholen wie Ethanol in Gegenwart von einem Äquivalent Amin bei 50 bis 100°C. Die für die Umsetzung benötigten Diester XI, sind literaturbekannt oder können in Anlehnung an beschriebene Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr., 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93).

Neben den vorstehend geschilderten Verfahren 1-7 zur Herstellung der Verbindungen la, Ib und Ic gibt es weitere Synthesemöglichkeiten, die den folgenden Literaturstellen zu entnehmen sind:

Beilstein, Hauptwerk sowie 1.-5. Erg.Werk, Band 27; R.W. Wiley, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Five- and Six-Membered Compounds with Nitrogen and Oxygen, Interscience Pubishers, New York, London (1962), Heterocyclic Chemistry, Vol. 6, Five-membered Rings with Two or More Oxygen, Sulfur or Nitrogen Atoms, Pergamon Press, 1984, J. March, Advanced Organic Chemistry, Third Adition, John Wiley and Sons, 1985, Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Auflage, Thieme Verlag, Bände IV, VI, VII, VIII, X.

Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Verbindungen la' und lb' kommen als Substituenten bevorzugt folgende Reste in Betracht:

X Sauerstoff oder Schwefel

R1. Wasserstoff;

35

Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere Fluor und Chlor;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 1,5-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl und iso-Propyl, welches ein bis fünf Halogenatome, insbesondere Fluor-

und/ oder Chloratome oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, insbesondere Cyclopropyl; Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 2-Methylethoxy, n-Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 1,1-Dimethylethoxy; Halogenalkoxy wie Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, insbesondere Trifluormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 0der Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano oder Nitro;

Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, und Cycloctyl, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Chlor und Fluor:

Alkenyi wie Ethenyi, 1-Propenyi, 2-Propenyi, 1-Methylethenyi, 1-Butenyi, 2-Butenyi, 3-Butenyi, 1-Methyl-1propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-pentenyi, 4-Pentenyi, 1-Methyi-1-butenyi, 2-Methyi-1-butenyi, 3-Methyi-2-butenyi 1-Methyi-2-butenyi, 2-Methyi-2butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,1-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Mehyl-3-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyi, 4-Methyi-3-pentenyi, 1-Methyi-4-pentenyi, 2-Methyi-4-pentenyi, 3-Methyi-4-pentenyi, 4-Methyi-4-pentenyi tenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2methyl-2-propenyl, insbesondere Allyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie obengenannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy. und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, Propargyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Alkinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-4-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl, insbesondere Propargyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere lod; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbeson-

dere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

- 5 C1-C4-Alkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio wie obenstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio wie obenstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio;
  - Phenoxy oder Phenyithio, wobei diese Reste ein bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkyithio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Furanyl, 2-Thienyl, 2-Furanyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Furanyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Furanyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 3-Isothiazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 4-Pyrrazolyl, 4-Pyrrazolyl, 5-Pyrrazolyl, 4-Pyridyl, 3-Pyridyl und 2-Pyridyl, wobei dieser Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie oben genannt, insbesondere Methyl; Halogen wie oben genannt, Insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Etoxy oder Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl; Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie bei R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy; Halogenalkoxy wie
- Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Meth oxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydroxazol-2-yl oder den Rest -COYR<sup>5</sup>

35 und

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R5 Wasserstoff;

Alkyl, wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl und n-Hexyl, welches ein bis fünf Halogenatome wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkoxy-alkoxy wie Methoxy-ethoxy, Ethoxy-ethoxy, Propoxy-ethoxy, insbesondere Methoxy-ethoxy; Cyano; Trimethylsilyl; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino, Propylamino, iso-Propylamino, insbesondere Methylamino und Ethylamino; Dialkylamino wie Dimethylamino, Diethylamino, Dipropylamino, Disopropylamino, Methylethylamino, insbesondere Dimethylamino und Methylethylamino; Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino und Cycloheptylamino, insbesondere Cyclopropylamino; Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, iso-Propylsulfinyl, insbesondere Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl; Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, iso-Propylsulfonyl, insbesondere Methylsulfonyl und Ethylsulfonyl; Carboxyl; Alkoxycarbonyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Dialkylaminocarbonyl wie Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dipropylaminocarbonyl, Disopropylaminocarbonyl, Dicyclopropylaminocarbonyl, Methylethylaminocarbonyl, Insbesondere Dimethylaminocarbonyl und Diethylaminocarbonyl; Dialkoxyphosphonyl wie Dimethoxyphosphonyl, Diethoxyphosphonyl, Dipropoxyphosphonyl, Diisopropoxyphosphonyl, insbesondere Dimethoxyphosphonyl und Diethoxyphosphonyl nyl; Alkaniminoxy wie insbesondere 2-Propaniminoxy; Thlenyl, Furanyl, Tetrahydrofuranyl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy; Benzoyl, wobel die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, oder Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere

Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro und Cyano;

- C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkoxycarbonyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, Nitro und Cyano;
- 10 C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkenyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Allyl und Methallyl, C<sub>5</sub>-C<sub>5</sub>-Cycloalkenyl wie 2-Cyclopentenyl und 2-Cyclohexenyl, insbesondere 2-Cyclohexenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Propargyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere lod, oder Phenyl, welches seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethox wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethox wie unter R¹ genannt, insbesondere Methox und Ethox wie unter R¹ genannt,
- insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro oder Cyano;
- einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie unter R¹ genannt, insbesondere Tetrahydrofuranyl und Tetrahydropyranyl oder einen Benzotriazolrest;
- Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
- ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substitulertes Ammonium
- oder einen Rest -N = CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, wobei R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl wie unter R<sup>1</sup> genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Cycloalkyl wie unter R<sup>1</sup> genannt, insbesondere Cyclopropyl; Phenyl oder Furyl bedeuten oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern,
  - R3 Wasserstoff.
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, iso-Propyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio, oder Dialkylamino wie unter R⁵ genannt, insbesondere Dimethylamino;
  - Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, oder Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl;
  - R4 Hydroxy;
  - Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;
- Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl; das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio; Und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Dimethylamino und Diethylamino; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Gyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, wie bei R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano;
- drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, wie bei R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano; Nitro; Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio, oder Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio;
  - Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und CyclohexyL, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro oder Cyano;
- Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Allyl, Methallyl, Propargyl und 1.1-Dimethyl2-2-propinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei

der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl: Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, Insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere

- Trifluormethylthio; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro; ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff wie unter R¹ genannt, welcher ein bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor;
- Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und
- Chlor; Nitro; Cyano; Formyl; Alkanoyl wie Acetyl, Propionyl, Butyryl, insbesondere Acetyl; Halogenalkanoyl, wie Trifluoracetyl, Trichloracetyl, Pentafluorpropionyl, insbesondere Trifluoracetyl, oder Alkoxycarbonyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxycarbonyl;
  - Naphthyl, das ein- bis dreimal durch Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor substituiert sein kann,
- 20 oder

R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur - $(CH_2)_n$ - $V_p$ - $(CH_2)_q$ -, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl wie - $(CH_2)_3$ -, - $(CH_2)_4$ -, - $(CH_2)_5$ 

sowie deren umweltverträglichen Salze.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen la und lb, in denen R³ Wasserstoff bedeutet sowie solche, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;

Methoxy, Ethoxy, Propyloxy, 1-Methylethoxy, Butyloxy, 1-Methylpropyloxy, 2-Methylpropyloxy und 1,1-Dimethylethoxy;

Difluormethoxy und Trifluormethoxy;

Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;

Difluormethylthio und Trifluormethylthio;

R<sup>2</sup> einen Rest -COYR<sup>5</sup>;

R5

Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido, oder einen Rest -N =  $CR^6R^7$ ;  $R^6$ ,  $R^7$ 

40 Wasserstoff;

Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; Cyclopentyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl;

R<sup>4</sup> Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl;

Beispiele für sehr aktive Verbindungen der Formeln la und Ib sind in den nachstehenden Tabellen aufgeführt:

Tabelle A

5 (x = 0 oder S)Ia R2 **R**3 R4 R1 10 Н tert.-Butyl СООН н F tert.-Butyl COOH н cı COOH H tert.-Butyl СООН tert.-Butyl H Methyl СООН н tert.-Butyl Ethyl 15 СООН н tert.-Butyl n-Propyl tert.-Butyl COOH н iso-Propyl n-Butyl COOH tert.-Butyl tert.-Butyl СООН H iso-Butyl 20 tert.-Butyl н sek.-Butyl COOH tert.-Butyl COOH н tert.-Butyl tert.-Butyl COOH Н cyclo-Propyl tert.-Butyl COOH Н cyclo-Butyl 25 tert.-Butyl cyclo-Pentyl COOH н tert.-Butyl COOH Н cyclo-Hexyl COOH H tert.-Butyl cyclo-Heptyl tert.-Butyl COOH H cyclo-Octyl tert.-Butyl 1-Methylcyclopropyl COOH н 30 tert.-Butyl COOH н Trifluormethyl tert.-Butyl н COOH Chlordifluormethyl tert.-Butyl COOH H Pentafluorethyl tert.-Butyl COOH H Methoxymethy1 35 tert.-Butyl 1-Methylmethoxymethyl СООН Н tert.-Butyl COOH н 1-Methylmethoxyethyl tert.-Butyl COOH Н Ethoxymethy 1 tert.-Butyl COOH н Viny1 tert.-Butyl COOH н 40 Allyl tert.-Butyl СООН н Methallyl tert.-Butyl COOH H Crotyl tert.-Butyl COOH H

55

45

50

Ethinyl

Methoxy

Ethoxy

Propargy 1

Phenylethinyl

**Trifluormethoxy** 

Methylthio

COOH

COOH

COOH

СООН

СООН

СООН

н

н

н

н

Н

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

R1	R2	R3	R4
Trifluormethylthio	СООН	н .	tertButyl
Phenoxy	СООН	н	tertButyl
4-C1-Phenoxy	СООН	н	tertButyl
2,4-(C1,C1)-Phenoxy	СООН	н	tertButyl
4-CF <sub>3</sub> -Phenoxy	соон	н	tertButyl
Phenyl	СООН	н	tertButyl
2-F-Phenylthio	COOH	н	tertButyl
3-F-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2,4-(F,F)-Pheny1	СООН	н	tertButyl
2-C1-Phenyl	СООН	н	tertButyl
3-C1-Phenyl	соон	н	tertButyl
2,4-(Cl,Cl)-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	tertButyl
3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	tertButyl
4-CH <sub>3</sub> -Pheny l	СООН	н	tertButyl
2,4-(CH <sub>3</sub> ,CH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2, 4, 6- (CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	tertButyl
2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	tertButyl
2, 4-(OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
4-OCF 3-Phenyl	СООН	н	tertButyl
4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	tertButyl
3-SCF 3-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	COCH	н	tertButyl
4-NO <sub>2</sub> -Pheny l	COOH	н	tertButyl
2-Thienyl	СООН	н	tertButyl
.3-Thienyl	COOH	н	tertButyl
2-Furanyl	СООН	н	tertButyl
3-Furanyl	СООН	н	tertButyl
2-Tetrahydrofuranyl	СООН	н	tertButyl
3-Tetrahydrofuranyl	СООН	н	tertButyl
2-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
3-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
4-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
2-Tetrahydropyranyl	СООН	н	tertButyl
3-Tetrahydropyranyl	COOH	н	tertButyl
4-Tetrahydropyranyl	СООН	н	tertButyl
iso-Propoxy	СООН	Н	tertButyl
Н	СООН	H	cyclo-Propyl
F	СООН	Н	cyclo-Propyl
Cl	СООН		cyclo-Propyl

R1	. R2	R3	R4
Methyl	СООН	н	cyclo-Propyl
Ethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
n-Propyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
iso-Propyl	СООН	н	cyclo-Propyl
n-Butyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
iso-Butyl	СООН	н .	cyclo-Propyl
sekButyl	соон	Н	cyclo-Propyl
tertButyl	соон	н	cyclo-Propyl
cyclo-Propyl	соон	н	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	соон	н	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	СООН	н	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	СООН	H	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	соон	н	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Pentafluorethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
Methoxymethyl	соон	н	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
Ethoxymethy l	СООН	Н	cyclo-Propyl
Vinyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Allyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Crotyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	H	cyclo-Propyl
Propargyl	COOH	H	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
Methoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
Ethoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
Methylthio	COOH	Н	cyclo-Propyl
Trifluormethylthio	COOH	Н	cyclo-Propyl
Phenoxy	СООН	Н	cyclo-Propyl
4-Cl-Phenoxy	СООН	H	cyclo-Propyl
2,4-(C1,C1)-Phenoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
4-CF <sub>3</sub> -Phenoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
2-F-Phenylthio	СООН	H	cyclo-Propyl
3-F-Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
2,4-(F,F)-Phenyl	СООН	H	cyclo-Propyl

5	R1	R2	R3 .	R4 ·
	2 C1 Dhomul	00011		avala Openul
	2-C1-Pheny 1	COOH	H	cyclo-Propyl
	3-C1-Pheny1	COOH	Н	cyclo-Propyl
10	2,4-(C1,C1)-Pheny1	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2, 4-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	COOH	H H	cyclo-Propyl
15	2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Pheny l	COOH	H	cyclo-Propyl cyclo-Propyl
	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2,4-(OCH <sub>3</sub> ,OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
20	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	n H	cyclo-Propyl
	3-SCF <sub>3</sub> -Phenyl	СООН		cyclo-Propyl
	2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Pheny l		H	•
25	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl cyclo-Propyl
	2-Thienyl		H	cyclo-Propyl
	3-Thienyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-Furanyl	COOH	H	cyclo-Propyl
30	3-Furanyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-Tetrahydrofuranyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-Pyridyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
35	3-Pyridyl	COOH	H	cyclo-Propyl
00	4-Pyridyl	COOH	H H	cyclo-Propyl
	2-Tetrahydropyranyl	COOH		cyclo-Propyl
	3-Tetrahydropyranyl	COOH	H H	cyclo-Propyl
	4-Tetrahydropyranyl	COOH		cyclo-Propyl
40	iso-Propoxy	COOH	H Methyl	tertButyl
	н .	COOH	Methyl	tertButyl
	F	COOH	Methy i	tertButyl
	C1	COOH	Methyl	tertButyl
45	Methyl	COOH	Methyl	tertButyl
	Ethyl	COOH	Methyl	tertButyl
	n-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
	iso-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
50	n-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
	iso-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
	sekButyl	COOH	Methyl	tertButyl
	tertButyl		Methyl	tertButyl
55	cyclo-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
	cyclo-Butyl	COOH	He city t	

<u>R1</u>	R2	R3	R4
cyclo-Pentyl	СООН	Methyl	tertButyl
cyclo-Hexyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Heptyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Octyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Chlordifluormethyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Pentafluorethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Vinyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Allyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Propargyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Phenylethinyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy	соон	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethoxy	соон	iso-Propyl	tertButyl
Н	соон	Methy1	cyclo-Propyl
F	соон	Methyl	cyclo-Propyl
Cl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
Methyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
Ethyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
n-Propyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Propyl	соон	Methyl .	cyclo-Propyl
n-Butyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
tertButyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Propyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	соон	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	соон	Methy l	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl

R1	R2	R3	R4
Pentafluorethyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Crotyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Propargyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl

	Tabelle	В
;	•	

cyclo-Heptyl

cyclo-Octyl

Trifluormethyl

Pentafluorethyl

Methoxymethy 1

**Ethoxymethyl** 

Vinyl

Allyl

Crotyl

Ethinyl

Methoxy

Ethoxy

Methy 1thio

Propargyl

Phenylethinyl

Trifluormethoxy

Methallyl

35

40

45

50

55

1-Methylcyclopropyl

Chlordifluormethyl

1-Methy Imethoxymethy 1

1-Methy lmethoxyethy l

COOH

COOH

СООН

COOH

COOH

COOH

COOH

COOH

СООН

COOH

COOH

COOH

COOH

COOH

COOH

СООН

COOH

COOH

COOH

COOH

H

Н

Н

н

H

H

H

Н

H

H

н

Н

н

н

н

н

H

н

н

н

tert.-Butyl

5	R1	R2	R3 .	R4
	Trifluormethylthio	COOL	4.2	A A Bushus
	-	COOH	H	tertButyl
	Phenoxy		Н	tertButyl
10	4-C1-Phenoxy	COOH	H	tertButyl
	2,4-(C1,C1)-Phenoxy	СООН	H	tertButyl
	4-CF <sub>3</sub> -Phenoxy	СООН	H 	tertButyl
	Phenyl	СООН	H	tertButyl
15	2-F-Phenylthio	СООН	н	tertButyl
	3-F-Phenyl	COOH	H	tertButyl
	2,4-(F,F)-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2-C1-Phenyl	COOH	H	tertButyl
	3-C1-Pheny1	СООН	H	tertButyl
20	2,4-(C1,C1)-Phenyl	СООН	H	tertButyl
	2-CH <sub>3</sub> -Pheny l	СООН	H	tertButyl
	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	H	tertButyl
	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	H	tertButyl
25	2,4-(CH <sub>3</sub> ,CH <sub>3</sub> )-Pheny1	COOH	Н	tertButyl
	2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	COOH	H	tertButyl
	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	Н	tertButyl
	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	Н	tertButyl
30	2,4-(OCH <sub>3</sub> ,OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	4-OCF 3-Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	3-SCF <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
35	2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Pheny l	COOH	н	tertButyl
35	4-NO <sub>2</sub> -Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2-Thieny l	СООН	Н	tertButyl
	3-Thieny l	COOH	Н	tertButyl
	2-Furanyl	СООН	н	tertButyl
40	3-Furanyl	СООН	н	tertButyl
	2-Tetrahydrofuranyl	СООН	Н	tertButyl
	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	tertButyl
	2-Pyridyl	СООН	Н	tertButyl
45	3-Pyridyl	СООН	Н	tertButyl
	4-Pyridyl	СООН	Н	tertButyl
	2-Tetrahydropyranyl	СООН	н .	tertButyl
	3-Tetrahydropyranyl	СООН	Н	tertButyl
50	4-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	tertButyl
	iso-Propoxy	СООН	н	tertButyl
	н	СООН	н .	cyclo-Propyl
	F	COOH	Ĥ	cyclo-Propyl
55	C1	СООН	Н	cyclo-Propyl
33	Methyl	COOH	Н	cyclo-Propyl

5	R1	R2	R3	R4
	PAL1	СООН	н	cyclo-Propyl
	Ethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	n-Propyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
10	iso-Propyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	n-Butyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	iso-Butyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	sekButyl	СООН	н	cyclo-Propyl
15	tertButyl	СООН	н	cyclo-Propyl
.0	cyclo-Propyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Butyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Pentyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Hexyl	COOH	H	cyclo-Propyl
20	cyclo-Heptyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Octyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	1-Methylcyclopropyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Trifluormethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
25	Chlordifluormethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Pentafluorethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	Methoxymethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	1-Methylmethoxymethyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
30	1-Methylmethoxyethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Ethoxymethy l	COOH	Н	cyclo-Propyl
	Vinyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	Allyl	COOH	H	cyclo-Propyl
35	Methallyl		H	cyclo-Propyl
33	Crotyl	COOH		cyclo-Propyl
	Ethinyl	COOH	Н.	cyclo-Propyl
	Propargyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	Phenylethinyl	COOH	H	cyclo-Propyl
40	Methoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	Ethoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	Trifluormethoxy	COOH	H H	cyclo-Propyl
	Methylthio	COOH		cyclo-Propyl
45	Trifluormethylthio	COOH	H	cyclo-Propyl
	Phenoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-C1-Phenoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
50	4-CF <sub>3</sub> -Phenoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	Pheny l	COOH.	H	cyclo-Propyl
	2-F-Phenylthio	COOH.	H	cyclo-Propyl
	3-F-Pheny l	COOH	H H	cyclo-Propyl
55	2,4-(F,F)-Phenyl	COOH		cyclo-Propyl
	2-Cl-Phenyl	СООН	H	cjelo (Topj.

<u>R1</u>	R2	R3	R <sup>4</sup>
3-Cl-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	H	cyclo-Propyl
3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2,4-(CH <sub>3</sub> ,CH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	 Н	cyclo-Propyl
2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-0CH <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2, 4- (OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
4-0CF 3-Pheny1	COOH	н	cyclo-Propyl
4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
3-SCF <sub>3</sub> -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2-Thienyl	COOH	н	cyclo-Propyl
3-Thienyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Furanyl	COOH	н	cyclo-Propyl
3-Furanyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
3-Tetrahydrofuranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Pyridyl	COOH	 Н	cyclo-Propyl
3-Pyridyl	COOH	.; Н	cyclo-Propyl
4-Pyridyl	COOH	 Н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydropyranyl	COOH	.; Н	cyclo-Propyl
3-Tetrahydropyranyl	COOH	.; Н	cyclo-Propyl
4-Tetrahydropyranyl	COOH	н .	cyclo-Propyl
iso-Propoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
H	COOH	Methyl .	tertButyl
F	COOH	Methyl	tertButyl
cı	COOH	Methyl	tertButyl
Methyl	СООН	Methyl	tertButyl
Ethyl	COOH	Methyl	tertButyl
n-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
iso-Propyl	COOH	Methy l	tertButyl
n-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
iso-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
sekButyl	COOH	Methyl	tertButyl
_	СООН	Methyl	tertButyl
tertButyl;	COOH	Methy l	tertButyl
cyclo-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
cyclo-Butyl cyclo-Pentyl	COOH	Methyl	tertButyl

R1	R2	R3 .	R <sup>4</sup>
cyclo-Hexyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Heptyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Octyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Chlordifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Pentafluorethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethy l	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethy l	СООН	iso-Propyl	tertButyl
•	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Vinyl Allyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
•	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Propargyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Phenylethinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
H	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
F	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
C1		Methyl	cyclo-Propyl
Methyl	COOH	•	cyclo-Propyl
Ethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
n-Propyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Propyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
n-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
tertButyl	СООН	iso-Propyl iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Propyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	COOH		cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
Pentafluorethyl.	COOH	Methyl	Cyclo-Propy i

R1	R2	R3 ·	R4
Methoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethy 1	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Crotyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Propargyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethoxy	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl

5		>	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
		×	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S
10																					
15	2		-butinyl		3H5) 2	0	mino	mino		hanimino:	1) 2	13) 31-					13)3	:(CH3)2	5)2	осн 3) 2	15) 2
20		R5	4-Hydroxy-2-butinyl	N=C(C2H2)2	N=C(cyclo-C3H5)2	2-Butanimino	Cyclohexanimino	<b>Cyclooctanimino</b>	N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2-Furyl-methanimino	CH2CH2N(CH3)2	CH2CH2N+(CH3) 31	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>2</sub> CC1 <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH2CH20-N=C (CH3)	CH2PO (0C2H5) 2	сн(сн3)сн(осн3)	CH2-CON(C2H5)2
25	R1 X																				
30	bzw.											•									
35	l a	R4	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
40	~ ***	R3 R	±	±	I	I	I	I	×	I	I	Ξ	I	I	I	I	Ξ	<b>=</b>	Ξ		I
45	Z Z																				
50									-				. ,			ropvl	Sa-Propy1	so-Propv]	so-Prony]	so-Pronvl	iso-Propyl
55		18	10142	Chlor	Chlor	Chlor	Chlor	Chlor	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	iso-Propv	1 S.OP	Q-07:	9-00	9-07	iso-P

- 55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	_	
. 18			R3	# <b>4</b>			RS			*	>	
iso-Probyl			I	tertButyl			Benzyl			ဟ	0	
CVC10-Propy	Dy1		I	tertButyl			2, 4-(C1, C1)-Benzyl	)-Benzyl		S	0	
cvclo-Propyl	Dy 1		I	tertButyl			3-Pyridyl-methyl	nethyl		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	tertButyl			2-Thienyl-methyl	nethy1		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	tertButyl			2-Tetrahydı	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	thyl	S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	tertButyl			2-Furanyl-methyl	nethyl		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	tertButyl			2-Pyridyl-methyl	nethyl		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	tertButyl			Phenyl			S	0	
Allyl	•		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	0	
Allyl			Ŧ	tertButyl			4-Trifluor	4-Trifluormethylphenyl		S	0	
Allyl			I	tertButyl			2-NO <sub>2</sub> -4-F-Phenyl	Phenyl		လ	0	
Allyl			I	tertButyl			3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl	F <sub>3</sub> )-Phenyl		S	0	
Allyl			I	tertButyl			4-0CH <sub>3</sub> -Pheny	ny 1		S	0	
Allyl			I	tertButyl			4-0CF <sub>3</sub> -Phenyl	ny l		S	0	
Allyl			I	tertButyl			4-NHCOCH <sub>3</sub> -Phenyl	Phenyl		S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			2-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			2-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			1-Benzotriazolyl	azolyl		S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			Methy 1			S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			Ethyl			S	0	
Ethinyl			Ŧ	tertButyl			n-Propyl			S	0	
Ethinyl			I	tertButyl			iso-Propyl			S	0	
Methoxy			I	tertButyl			n-Butyl			S	0	
Methoxy			I	tertButyl			iso-Butyl			S	0	
Methoxy			I	tertButyl			sekButyl			ဟ	0	

40 ∞ ∝	30 35	15 20 ເກ ແລ	10	5 <b>≍</b>	>
2					
tertButy	utyl	tertButyl		n (	<b>)</b>
tertButy	utyl	cyclo-Hexyl		'n	0
tertButy	utyl	Cyclopropylmethyl		ဟ	0
tertButy	utyl	Ethoxymethyl		S	0
tertButy	ıtyl	2-Methoxy-ethoxy-methyl	ethyl	S	0
tertButyl	ıtyl	Benzyloxymethyl		s	0
tertButy	ıtyl	(4-Brombenzoyl)-methyl	thyl	S	0
tertButyl	ıtyl	(4-Methoxybenzoyl)-methyl	-methyl	S	0
tertButy	tyl	<b>Phthalimidomethyl</b>		S	0
tertButy	tyl	Methylthiomethyl		S	0
tertButy	tyl	. 2-Thiomethyl-ethyl		S	0
tertButy	tyl	CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )C00CH <sub>3</sub>		S	0
tertButy	tyl	Pheny lethy l		S	0
tertButy	ıtyl	4-F-Phenylethyl		S	0
tertButy	ıtyl	Phthalimido		S	0
tertButy	ıtyı	Tetrahydrophthalimido	ido	S	0
tertButy	tyl	Maleinimido	•	S	0
tertButy	ıtyl	Succinimido		S	0
tertButy]	ıtyl	Piperidino		S	0
tertButy	ıtyl	<b>Li</b> +		S	0
tertButy	tyl	Na+		S	0
tertButy	ıtyl	±±		S	0
tertButy	utyl	+*HN		S	0
tertButy	Jutyl	Diisopropylammonium	E	S	0
tertButyl		2-Hydroxyethyl-aṃmonium	on i um	S	0

- 55	<b>50</b>	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
R.		R3	R.	·		R5				×	*
2-Thienyl		I	tert, -Butyl	Butyl		Allyl	_			s	0
2-Thienyl		I	tertButyl	Butyl		Meth	Methallyl			s	0
2-Thienyl		I	tertButyl	Butyl		2-ch	2-Chlorallyl			s	0
2-Thienyl		I	tertButyl	Butyl		Prop	Propargyl			s	0
2-Thienyl		=	tertButyl	Butyl		3-10	3-Iodpropargyl			s	0
Chlor		<b>=</b>	cyclo-Propyl	Propyl		4-Hy	4-Hydroxy-2-butinyl	inyl		s	0
Chlor		x	cyclo-Propyl	Propyl		N=C	N=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>			.v	0
Chlor		I	cyclo-Propyl	ropyl		N=C	N=C(cyclo-C3H5)2	7		s	0
Chlor		I	cyclo-Propy	ropyl		2-Bu	2-Butanimino			s	0
· Chlor		Ŧ	cyclo-Propyl	ropyl		Cycl	Cyclohexanimino			s	0
Chlor		I	cyclo-Propyl	ropyl		Cycl	Cyclooctanimino			s	_
Methyl	•	I	cyclo-Propyl	ropyl		N=CH	N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>			S	_
Methyl		I	cyclo-Propyl	ropyl		2-Fu	2-Furyl-methanimino	mino		s	_
Methyl		I	cyclo-Propy	ropyl		CH <sub>2</sub> C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			s	_
Methyl		I	cyclo-Propyl	ropyl		CH <sub>2</sub> C	CH2CH2N+(CH3)3I	,		s.	_
Methyl		I	cyclo-Propyl	ropyl		CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F <sub>3</sub>			s	0
Methyl		I	cyclo-Propy	ropyl		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	н2С1			s	0
Methyl		I	cyclo-Propyl	ropyl		CH <sub>2</sub> C	CH2CH2CN			s o	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl	ropyl		CH <sub>2</sub> CC <sub>13</sub>	Cl <sub>3</sub>			s o	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propy]	ropyl		CH <sub>2</sub> C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>			s	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propy	Propyl		CH <sub>2</sub> C	CH2CH20-N=C(CH3)	) 2		o s	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl		CH <sub>2</sub> P	CH2PO (OC 2H5) 2			s	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl		OH)	сн(сн3)сн(осн3)	2		s o	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl		CH <sub>2</sub> -	CH2-CON(C2H5)2			s o	_
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl	Propyl		Benzyl	y			o s	_

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5		
R1			83	R4			R5			*	-	
cvclo-Probyl	l va		I	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Benzyl	)-Benzyl		S	0	
cyclo-Propy	py 1		I	cyclo-Propyl	٠		3-Pyridyl-methyl	methyl		S	0	
cyclo-Propy	lyd		×	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methyl	methyl		S	0	
cyclo-Propy	lydo		Ŧ	cyclo-Propyl			2-Tetrahyd	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	ethyl	S	0	
cyclo-Propy	lyde		Ŧ	cyclo-Propyl			2-Furanyl-methy	methy		S	0	
cyclo-Propyl	opyl		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	methyl		S	0	
cyclo-Propy	opyl		I	cyclo-Propyl			Phenyl			S	0	
Allyl	<u>.</u>		Ŧ	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-Trifluor	4-Trifluormethylphenyl	-	S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			2-NO <sub>2</sub> -F-Phenyl	enyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			3, 5-(cF <sub>3</sub> , c	3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-OCH <sub>3</sub> -Pheny1	nyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-0CF <sub>3</sub> -Pheny	ınyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-NHCOCH <sub>3</sub> -Phenyl	Phenyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydropyranyl	lropyrany l		s	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydrofuranyl	Irofuranyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			1-Benzotriazolyl	azolyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			Methyl			S	0	
Ethinyl			Ξ	cyclo-Propyl			Ethyl			S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			n-Propyl			vo.	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			n-Butyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			iso-Butyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			sekButyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			tertButyl	~		S	0	

- 55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	•	5	
7			0	40				2			. <b>×</b>	>	
-													
Methoxy	-		I	cyclo-	cyclo-Propyl			cyclo-Hexyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-	cyclo-Propyl			Cyclopropylmethyl	lmethyl		တ	0	
Methoxy	. >-		I	cyclo-	cyclo-Propyl			Ethoxymethyl			S	0	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo-	cyclo-Propyl			2-Methoxy-6	2-Methoxy-ethoxy-methyl	-	S	0	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo-	cyclo-Propyl			<b>Benzyloxymethyl</b>	ethyl		S	0	
4-C1-P	henoxy		I	cyclo-	cyclo-Propyl			(4-Brompens	(4-Brombenzoyl)-methyl		တ	0	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo-	cyclo-Propyl			(4-Methoxyt	(4-Methoxybenzoyl)-methyl	thy 1	S	0	
4-C1-PI	henoxy		I	cyclo-	cyclo-Propyl			Phthalimidomethy	omethyl		ဟ	0	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo.	cyclo-Propyl			Methylthiomethy	nethy l		S	0	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo.	cyclo-Propyl			2-Thiomethyl-ethyl	/l-ethyl		S	0	
Phenylthio	thio		I	cyc lo	cyclo-Propyl			сн(сен5)соосн3	OCH 3		S	0	
Phenylthio	thio		I	cyclo.	cyclo-Propyl			Phenylethyl	_		S	0	
Phenylthio	thio		I	cycle	cyclo-Propyl			4-F-Phenylethyl	ethyl		S	0	
Phenylthio	thio		r	cycle	cyclo-Propyl			<b>Phthalimido</b>	0		လ	0	
Phenylthio	thio		I	cycl	cyclo-Propyl			Tetrahydro	<b>Tetrahydrophthalimido</b>		S	<b>o</b> .	
Phenylthio	thio		Ξ	cycl	cyclo-Propyl			Maleinimido	•		S	0	
Phenylthio	thio		I	cyclo	cyclo-Propyl			Succinimido	0		S	0	
2, 4-(0	2,4-(C1,C1)-Phenyl		I	cyclo	cyclo-Propyl			Piperidimo			S	0	
2, 4-(0	1, C1)-Phenyl		I	cyclo	cyclo-Propyl			Li+			S	0	
2, 4-(C	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		Ŧ	cyclo	cyclo-Propyl			Na+			S	0	
2. 4- (C	1, C1)-Phenyl		I	cyclo	cyclo-Propyl			<del>+</del>			S	0	
2.4-(0	l, Cl)-Phenyl		I	cyclo	cyclo-Propyl			NH + +			S	0	
2.4-(C	:1.C1)-Phenyl		Ξ	cyclo	cyclo-Propyl			Di isopropylammonium	l ammon i um		S	0	
2, 4- (C	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		I	cyclo	cyclo-Propyl			2-Hydroxye	2-Hydroxyethyl-ammonium		S	0	
2-Thienyl	ınyı		I	cyclo	cyclo-Propyl			Allyl			S	0	

50 - 55	45	40	35	30	25	20	16	10	5	
R1	R.3	R4			œ	RS			×	_
2-Thienyl	Ŧ	cyclo-	cyclo-Propyl		•	Methallyl			'n	<b>.</b>
2-Thienyl	I	cyclo-	cyclo-Propyl		7	2-Chlorallyl			S	0
2-Thienyl	I	cyclo-	cyclo-Propyl		_	Propargyl			s	0
2-Thienyl	I	cyclo-	cyclo-Propyl		(e)	3-Iodpropargyl	_		S	0
	I	tertButy	-Butyl		•	-N=C(CH3)2			S	0
: <b>1</b>	I	tertButy	-Butyl		•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
. ວ	I	tertButy	-Butyl		1	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			တ	0
Methyl	I	tertButy	-Butyl		•	-N=C(CH3)2			S	0
Ethvl	I	tertButy	-Butyl		•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
n-Propv1	I	tertButy	-Butyl		•	-N=C(CH3) <sub>2</sub>			S	0
iso-Propy1	I	tert.	tertButyl		•	-N=C(CH₃)₂			ဟ	0
n-Butvl	I	tert.	tertButyl		•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
iso-Butvi	<b>=</b>	tert.	tertButyl		•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
sek.'-Butvl	Ξ	tert.	tertButyl		•	-N=C (CH3) 2			S	0
tertButyl	I	tert.	tertButyl		•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
cvclo-Propyl	I	tert.	tertButyl		T	-N=C(CH3)2			S	0
cvclo-Butvl	I	tert.	tertButyl		T	-N=C(CH3)2			S	0
cvclo-Pentyl	Ξ	tert.	tertButyl		7	-N=C(CH3)2			S	0
cvclo-Hexvl	I	tert.	tertButyl		T	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
cyclo-Hebtyl	Ξ	tert.	tertButyl		7	-N=C(CH3)2			S	0
cvclo-Octvl	I	tert.	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
1-Methylcyclopropyl	<b>=</b>	tert.	tertButyl		T	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
Trifluormethyl	I	tert.	tertButyl		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Chlordifluormethyl	I	tert.	tertButyl		ī	-N=C(CH3)2			S	0
Pentafluormethyl	Ξ	tert.	tertButyl		1	-N=C(CH3)2			S	0

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5		
18			R3	R4			R5			×	>	
i so-Propoxy	χ		×	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
Methoxymethyl	thvl		I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
1-Methylm	1-Methylmethoxymethyl		x	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
1-Methylm	1-Methylmethoxyethyl		Ŧ	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Ethoxymethyl	lvl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
Vinvl	•		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Allvl			Ŧ	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methallyl			I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Crotvl			I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Ethinyl			Ŧ	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Proparayl			I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Phenyleethinyl	hinyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methoxy	•		Ŧ	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Ethoxy			Ĭ	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Trifluormethoxy	nethoxy		Ŧ	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methylthio			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			v	0	
Trifluom	Trifluormethylthio		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Phenoxy	•		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
4-Cl-Phenoxy	YXOL		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
2.4-(C1.0	2. 4-(C1, C1)-Phenoxy		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
4-CF a-Phenoxy	Axous		I	tertButyl			-N=C (CH3)2			တ	0	
Phenyl	•		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
2-F-Phenvlthio	vlthio		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
3-F-Phen			I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
2, 4-(F, F)-Phenyl	)-Phenyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	

R	<b>45</b> 50	40	35 40	30	25	20	15	10	5	
H tertButyl H		83	R4			R5			*	-
H		3	+a+ -Rutel			-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0
H	-Pneny I	: 3	tert -Butvl			_			S	0
H   tert.=Buty	-Pneny i	= 3	tort -Butvl			_			s	0
H   tertButy	(c1, c1)-rnenyı	5 3	+ort -butvl			-N=C(CH <sub>2</sub> ),			S	0
HertButy	l <sub>3</sub> -Pheny1	<b>E</b> 3	tertbuty1			-N=C(CH <sub>3</sub> ) 2			S	0
-Phenyl	(3-Phenyl	= =	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
H tertButyl	13-Filefiy (	: <b>x</b>	tertButyl			-N=C(CH3) 2			S	0
H tertButyl	6-(CH <sub>2</sub> , CH <sub>2</sub> , CH <sub>3</sub> ) -Pheny	: <b>=</b>	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
H tertButyl  -N=C(CH3)2  S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	5 (cm3/ cm3/ cm3/ cm3/ cm2/	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
H tertButyl -N=C(CH3)2 S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	CHa-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
H tertButyl	-(OCH 3. OCH 3) -Pheny l	Ξ	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
-Phenyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CF 3-Phenyl	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
-Phenyl H tertButyl -N=C(CH3)2	CH2-Phenv]	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
H tertButyl	CF Pheny!	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0
H tertButyl	-(NO NO) -Pheny	I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
H tert,-Butyl  H tertButyl	OPhenyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0
H tertButyl  H tertButyl  -N=C(CH3)2  H tertButyl  -N=C(CH3)2  Acofuranyl  H tertButyl  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  H tertButyl  -N=C(CH3)2  S  H tertButyl  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2  S  -N=C(CH3)2	hienvi	I	tert, -Butyl			-N=C(CH3)2			S	0
H tertButy	hienv1	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0
H tertButy  -N=C(CH3)2   S	( in and )	1	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0
drofurany		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0
H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S	aranyi etrahvdrofiiranvl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			s	0
H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S	etrahydrofuranyl	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			s	0
H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S	vridv]	I	tertButy			-N=C(CH3)2			S	0
H tertButyl -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> S	yridy!	I	tertButy			-N=C (CH3) 2			S	0
	yridyl	I	tertButy			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0

- 55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	_	
R1			R3	R4			R5			*	>	
2-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
3-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		I	tertButyl	•		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
4-Tetrahydropyranyl	lropyranyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
<b>=</b>			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
Ŀ			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
15			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methyl			I	cyclo-Propyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Ethyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
n-Propyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
iso-Propyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			s	0	
n-Butyl	•		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
iso-Butyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH₃)2			S	0	
sek. TButyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
tertButyl	=		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			s	0	
cyclo-Propyl	lkc		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	<b>o</b> _	
cyclo-Butyl	1		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
cyclo-Pentyl	tyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo-Hexyl	1		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo-Hept	tyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo-Octyl	-		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
1-Methylcy	1-Methylcyclopropyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	O	
<b>Trifluormethyl</b>	ethyl		I	cyclo-propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
<b>Chlordifluormethyl</b>	uormethyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Pentafluorethyl	rethyl		Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0	
iso-Propoxy	хх		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	

 55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5		
								u 6			,	>	
E.			2	R4				CX.			<	-	1
								- (- HJ) J-N-			S	0	
Methoxymethyl	thyl		I	cycle	cyclo-rropy:			7 (5113) 7				•	
1-Methyln	1-Methylmethoxymethyl	yl	Ŧ	cycle	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n ·	> '	
1-140+11418	1-Mothylmethoxyethyl	, –	I	cycle	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0	
I-Mecily line circ	thul	•	<b>.</b>	cvclc	cvclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Ethoxyme			: =	CVC	cvclo-Propvl			-N=C(CH3)2			S	0	
1111			: I	CVC	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
.Atty1			: =	CVC	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methally	<b>-</b>		: 2	יין טאַט	cyclo-repy			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Crotyl			: 3		cyclo ropy:			-N=C(CH1),			S	0	
Ethinyi			E 3		cyclo-riopy:			-N=C(CH1),			s	0	
Propargy	·		E 3		o-riopy:			-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0	
Phenylethinyl	hiny l		<b>E</b> :	Cyc.	cyclo-riopy:			-N=C (CH3) 2			S	0	
Methoxy			Í	cycl	cyclo-rropyı			2 (5113) 5-11			v	<b>-</b>	
Ethoxy			I	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n (	> 0	
Trifluormethoxy	methoxv		Ŧ	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n	0	
Mothylthio	i		I	Cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		٠	S	0	
Triffluor	metingleine Trifluormethvlthio		Ξ	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Op 1 1 1 1			<b>=</b>	cycl	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
K-C1-Shonovy	2		Ξ.	cvcl	cvclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
4-C1-rik	citody C11_obonov	3	. =	Cvcl	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
7, 4-101,	2, 4-(cl, cl)-rilelloxy	ח	: 3	ה לי ה	cyclo-propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			s	0	
4-CF 3-Phenoxy	nenoxy		: :					-N=C(CH3)3			S	0	
Phenyl			I	c S	cyclo-Propyl			7 (500)			u	•	
2-F-Phenylthio	nylthio		I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n (	<b>o</b>	
3-F-Phenyl	1 ^ 1		I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0	
2 4-(F.	2 4-(F.F)-Phenyl		I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
2-C1-Phenvl	envl		I	cyc	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		•	ဟ	0	
:	· ()												

55 55	40	35	30	25	20	15	10	5	_
81	83	4			RS			×	>
3-C1-Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Pheny	H	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2-0CH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2, 4-(OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			v	0
4-0CF <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
3-SOF <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> ) -Pheny l	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-Thienyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
3-Thienyl	Ξ	cyclo-Propyl			-N=C(CH₃)2			S	0
2-Furanyl	I	cyclo-Propyl		•	-N=C(CH3)2			S	0
3-Furanyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-Tetrahydrofuranyl	I	cyclo-Propyl		•	-N=C(CH3)2			S	0
3-Tetrahydrofuranyl	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
2-Pyridyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl	Ŧ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
4-Pyridy1	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-Tetrahydropyranyl	I	cyclo-Propyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0

50 55		45	40	35	30	25	20	15	10	5	
12			R 3	R4		R5				×	>
3-Tetrahydropyranyl	vranvl		I	cyclo-Propyl		-N=C (CH3)	CH3) 2			S	0
6-Tetrahydropyranyl	vranvl		Ξ	cyclo-Propyl		)= <b>N</b> -	-N=C (CH3) 2			S	0
t-leer any disp			: 1	Methyl		I				S	0
			: 2	Ethv]		I				S	0
Chlor			: =	n-Propy]	•	Ξ				s	0
Chlor Chlor			: =	iso-Propv1		I				s	0
Chlor			: =	n-Butyl		I				s	0
20113			: <b>I</b>	iso-Butyl		<b>=</b>				s	0
Mothy.			<b>.</b>	sekButyl		I				s	0
Methyl			: <b>=</b>	n-Pentyl		I				S	0
Methyl			I	2-Pentyl		I				S	0
Mothyl			I	3-Pentyl		I				S	0
Methyl			I	n-Hexyl		I				S	0
Methyl			÷	2-Hexyl		I				S	0
iso-Pronvi			I	3-Hexy1		±				S	0
iso-Probvi			I	2-Methyl-2-pentyl	-	I				S	0
iso-Propvl			I	cyclo-Propylmethyl	yl	I				S	0
iso-Propvl			I	cyclo-Butyl		I				S	0
iso-Propy)			Ŧ	cyclo-Pentyl		Ŧ			•	s	0
iso-Propvl			I	cyclo-Hexyl		I				S	0
cyclo-bronyl			Ξ	1-Methylcyclohexyl	l K	I				S	0
cyclo-Propyl			I	3-Trifluormethylcyclohexyl	cyclohexyl	I				S	0
cyclo-brond			I	Allyl		I				S	0
rvclo-Propyl			<b>=</b>	1-Buten-3-yl		I				S	0
cyclo-Propyl			I	Crotyl		I				S	0

- 55	50	45	40	35	25 30		20	. 15	10	5	
7			~ C			G G				×	>
2			2	K							
cvclo-Propyl	l yac		Ŧ	Propargyl		I				S	0
Allvl	2		Ξ	1-Butin-3-yl		I				S	0
Allvl			I	3-Methyl-1-butin-3-yl	:in-3-yl	I				S	0
Allyl			I	2-Pentin-4-yl		I			•	S	0
Allyl			I	Benzyl		I				ဟ	0
Allyl			I	2-Phenylethyl		I				S	0
Allyl			I	2-Methylthioethyl	thyl	I				S	0
Ethinvl			I	2-Chlorethyl	•	<b>=</b>				S	0
Ethinyl			I	2-Methoxyethyl	_	I				S	0
Ethinyl			I	2-(N, N-Dimethylamino)ethyl	ylamino)ethyl	I		-		S	0
Ethinyl			I	Phenyl		I				S	0
Ethinyl			I	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl		I				S	0
Ethinyl			I	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl		Ŧ				S	0
Methoxy			I	2, 4-(CH3, CH3)-Phenyl	-Pheny l	I				S	0
Methoxv			I	2, 3, 5-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	3, CH3)-Phenyl	I				s.	0
Methoxy			I	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl		I				S	0
Methoxy			I	3-F-Phenyl		I				S	0
Methoxy			I	2-Cl-Phenyl		I				S	0
Methoxv			I	4-Cl-Phenyl		Ξ				S	0
4-Cl-Phenoxy	Non		I	2, 4-(F, F)-Phenyl	nyl	I				S	0
4-Cl-Phenoxy	Axou		I	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Pheny <sup>1</sup>	C1)-Phenyl	I				S	0
4-C1-Phenoxy	Axou		I	2-CN-Pheny1		I				S	0
4-C1-Phenoxy	yxou		I	2-0CH <sub>3</sub> -Phenyl		Ξ.				S	0
4-C1-Phenoxy	ynoxy		I	2, 3-(OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	3)-Phenyl	I				S	0
4-C1-Phenoxy	yvons		I	3, 4, 5- (OCH <sub>3</sub> , 0	3, 4, 5-(OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Phenyl	H H				S	0

	R3	R4		R5		×	-
	3	3-0CF Bhonv1		Ξ		S	0
	= 3	/-OCE -CHEPheny		I		s	0
	E 3	2-SCH 2-Phony		: <b>=</b>		S	0
	= 3	2 July many: 7 h=(sch. sch.)-Phenv]	-Phenvl	I		S	0
	: <b>:</b>	2-SCF 3-Phenv1		I		S	0
Pnenylchio Dhanylthio	: I	4-NO,-Pheny]		<b>=</b>		S	0
7 /- (r) r)-Pheny	: =	2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	Pheny 1	I		S	0
2,4-(C1,C1)-Phenyl	<b>=</b>	2-CHO-Pheny 1		I		S	0
) -Phenyl	=	3-COCH <sub>3</sub> -Phenyl		I		S	0
) - Pheny ]	<b>=</b>	3-COCF <sub>3</sub> -Phenyl		I		S	0
)-Phenyl	Ŧ	1-Naphthyl		I		S	0
)-Phenyl	Ŧ	2-Naphthyl		I		S	0
	I	Piperidino		x		S	0
	Ξ	3-Tetrahydrofuranyl	ranyl	I		S	0
	Í	4-Tetrahydropyranyl	ranyl	I		s	0
	I	2-Thi azolyl		I		S	0
	=	5-CH <sub>3</sub> -2-Thiazolyl	lyl	I		Ŋ	0
	I	4-CH <sub>3</sub> -5-COOH-2-Thiazoly	-Thiazolyl	I		S	0
	=	Methyl		I		S	0
	: <b>=</b>	Ethvl		Ŧ		S	0
	<b>=</b>	n-Propyl		I		s	0
	*	iso-Propyl		I		S	0
	<b>.</b>	n-Butyl		I		S	0
	Ŧ	iso-Butylyl		I		S	0
	Mothy.	l sekButyl		I		S	0

5	>	0	0	C	• •	<b>o</b> (	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	<b>o</b>	0	0	0	C	•	<b>o</b>	0	0	0	0	0	
	×	S	S	C.		n (	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	S	·	•	SO .	S	S	S	S	S	
10																													
15					,				) 2	)2	)2	7 7	) 2	)2	)2	)2	)2	),		2 (	7 (	. 12	1) 2	1) 2	1) 2	1) 2	. (		7 / 6
20	RS	I	I	: =	E	I	Ŧ	I	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-:N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C(CH3)	-N=C (CH <sub>3</sub> )	-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C(CH <sub>3</sub> )	-N=C(CH1)	-N=C(CH <sub>3</sub> )	(CH2) J=N=		-N=(CH3)2	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH3)2	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ),	, (, HZ) 7=N=	
25																													
30												[ ^0	•	<b>~</b>	t < 1	· _			•				2-Methyl-2-pentyl	cyclo-Proplymethyl	utvl	entv1	. (c. 1.c.)	ichj.	l-Methylcyclonexyl
35	<b>8</b>	n-Pentvl			l 3-Pentyl	I n-Hexyl	1 2-Hexyl			Fthv]	n-Probvl	iso-Propy]	n-Rutvl	iso-Butv]	sekButvl	n-Pentyl	2-Penty	3-Bentul	J-reney	n-hexy 1	Z-Hexy I	3-Hexyl	2-Methy	cyclo-P	cvclo-Butvl	cyclo-Pentyl	cyclo renej	01262	I-Metny
40	R3	Methyl	1440	Herny	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	=	: I	: I	: 3	: 3	: I	: 1	: =	: 3	= =	<b>:</b> :	<b>E</b> :	I	I	=	I	I	: 3	= 3	<b>F</b> :	Ξ.
. <b>45</b>											-																		
<b>50</b>		[ " " " " " " " " " " " " " " " " " " "	i do la	so-Propy 1	So-Propyl	So-Propy1	so_pronv1	iso riopy:	re opyr	<b>i</b> :	. ioi	101	<u>.</u>	J01		Metnyi	Metny I	Metnyl	Methyl	Methy!	Methyl	iso-Propyl	So-Probyl	iso-Propyl	. Cond	Iso-Propy I	so-Propy	So-Propy I	cyclo-Propyl
55	. 2	100	2 .	150	150	iso	40.0	-	ין אַ	Calor	CHIOL	Calor	5 8	Chlor	5 3		E :	Ē	<b>X</b>	<b>E</b>	£	S				<u>s</u> .	<u>~</u>	<i>U</i> 1	S

- 55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	_	
R1			2	R4			R5			×	-	
				•	•					u	c	
cyclo-Propyl		I	_	3-Trifluormethylcyclohexyl	cyclonexyı		-N=C(CH3)2			,	•	
cvclo-Propvl			_	Allyl			-N=C(CH3)2			ဟ	0	
cyclo-Propyl		-3-	_	1-Buten-3-yl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo riopy:		. <b></b>	_	Crotyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo-riopy:				Propardyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
cyclo-riopy.				1-Butin-3-vl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Aliyi				3-Wethv1-1-butin-3-v1	1-3-v1		-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0	
Allyi		_		2-Pentin-4-vl			-N=C(CH3),			S	0	
Aliyi			. 5	Denzal			-N=C(CH <sub>1</sub> ),			S	0	
Allyi			E 3	2-phenylethyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Ailyl		-	c =	2-Methulthioethul	7		-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0	
Allyl		_	c 3	2-Chlorathyl	•		-N=C(CH <sub>2</sub> ) 2			s	0	
Ethiny			= =	2-Mathemathul			-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0	
Ethinyl			c 3	2-(c N-Dimethylamino)ethyl	aminolethyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ),			S	0	
Ethinyl			<b>.</b> :	2- (ii, N-Dimerny i			-N=C(CH <sub>3</sub> )			S	0	
Ethinyl			E	Freny (			2 (CH2) 2-N-			v	· C	
Ethinyl			I	2-CH <sub>3</sub> -Pheny1			-N=C(CH3)2			, (	•	
Ethinyl			I	4-CH3-Phenyl			-N=C(CH3)2			n	>	
Methoxy			I	2, 4-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	heny l		-N=C(CH3)2			S	0	
Mothox			<b>=</b>	2, 3, 5- (CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Phenyl	CH <sub>3</sub> )-Pheny1	•	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
Methoxy			. <b>.</b>	3-CF 1-Phenyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Methody			: 3	3-F-Phenyl	•		-N=C(CH3)2			S	0	
Methoxy			E :	o of phones			-N=C(CH))			S	C	
Methoxy			Ŧ.	2-CI-Pheny!			-M-c(cn3)2			•	•	
Methoxy			I	4-Cl-Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
4-C1-Phenoxy	>		I	2, 4-(F, F)-Phenyl	-		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	
4-C1-Phenoxy	· 5		I	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Phenyl	)-Phenyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0	

50		45	<b>40</b> .	35	30	20	15	10	5	
R1			83	R4		RS			×	<b>&gt;</b>
4-C1-Phenoxy			I	2-CN-Phenyl		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	٠		S	0
4-Cl-Phenoxy			I	2-0CH <sub>3</sub> -Pheny1		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			s	0
4-C1-Phenoxy			×	2, 3-(OCH3, OCH3)-Phenyl	)-Phenyl	-N=C (CH3) 2			တ	0
4-C1-Phenoxy			I	3, 4, 5- (OCH3, OC	3, 4, 5-(0CH3, 0CH3, 0CH3)-Phenyl	I -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
Phenylthio			Ŧ	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl		-N=C (CH3) 2			<b>တ</b>	0
Phenylthio			I	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> -Phenyl	nyl .	-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2-SCH <sub>3</sub> -Pheny1		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			Ŧ	2, 4-(SCH3, SCH3)-Pheny	)-Phenyl	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
Phenylthio			Ŧ	2-SCF <sub>3</sub> -Phenyl		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
Phenylthio			I	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-P	henyl		I	2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	Phenyl	-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(c1, c1)-Phenyl	henyl		I	2-CHO-Phenyl		-N=C (CH3) 2			တ	0
2, 4-(C1, C1)-f	henyl		I	3-COCH <sub>3</sub> -Pheny l		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2, 4-(C1, C1)-F	henyl		Ĭ	3-COCF <sub>3</sub> -Phenyl		-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(01,01)-6	heny l		I	1-Naphthyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2, 4-(c1, c1)-f	henyl		Ŧ	2-Naphthyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl	٠		I	Piperidinyl		-N=C(CH3)2			S	0
2-Thienyl			I	3-Tetrahydrofuranyl	ıranyl	-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	4-Tetrahydropyrany	ranyl	-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	2-Thiazolyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			S	0
2-Thienyl			I	5-CH <sub>3</sub> -2-Thiazolyl	ıyı	-N=C(CH3)2			S	0
2-Thienyl			I	4-CH <sub>3</sub> -5-C00H-2-Thiazoly	-Thiazolyl	-N=C(CH3)2			S	0
3-Pyridyl			I	Methyl		-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl			I	Ethyl		-N=C(CH3)2			S	0
3-Pyridyl		•	I	n-Propyl		-N=C(CH3)2			S	0

	R3	R4		RS		×	>
	Ŧ	iso-Propyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		S	0
	<b>=</b>	n-Buty}		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		ဟ	0
	: 1	iso-Butvl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		တ	0
	Methyl	sekButyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		S	0
	Mothyl	n-Pentyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		ဟ	0
	Methyl	2-Pentyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		တ	0
	Methy	3-Pentvl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		S	0
	Methyl	n-Hexv]		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		s	0
	Mothy	2-Hexv1		-N=C (CH3) 2		S	0
	Methyl	3-Hexv1		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		S	0
	Ξ	tertButvl		2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Pheny1	S	s
	: <b>=</b>	tertButyl		2-Pyridyl		S	S
	I	tertButyl		Ethyl		S	S
•	<b>=</b>	tertButyl		iso-Propyl		S	S
	: =	tertButyl		Butyl		S	S
	: 1	tertButyl		tertButyl		S	S
	: I	tertButyl		Phenyl		S	S
	: =	tertButyl		4-F-Phenyl		S	s
	: =	tertButyl		3-CF3-Phenyl		S	S
	: I	tertButvl		2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl	S	S
	: 3	tort -Butvl		2-Pyridyl		S	S
	<b>E</b> :	tont putil		Methyl		S	S
	E	tertBuryi		E+hv]		v	S
	I	tertButyl		ברוואו.		, (	، د
	I	tertButyl		iso-Propy!		n i	ח נ
cyclo-Propyl	Ŧ	tertButyl		Butyl		n	n

<b>55</b>	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
							ų i			,	>
2			2	R4			<sub>گ</sub> ئ			٠	-
cyclo-Propyl	lyı		I	tertButyl			tertButyl			S	S
cyclo-Prop	ı yı		I	tertButyl	-		Pheny l			S	S
cyclo-Propyl	ıyı		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	S
cyclo-Propyl	lk		I	tertButyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	-		ဟ	s
cyclo-Propy	y l		I	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	-Phenyl		S	S
cyclo-Propyl	y J		I	tertButyl			2-Pyridyl			S	S
Allyl	•		I	tertButyl			Methyl			S	S
Ally			I	tertButyl			Ethyl			S	တ
Ally			I	tertButyl			iso-Propyl			S	S
Allyl			I	tertButyl			Butyl			တ	S
Allyl			I	tertButyl			tertButyl			တ	S
Allyl			I	tertButyl			Phenyl			S	S
Methoxy			I	tertButyl	•		Methyl			Ń	s
Methoxy			I	tertButyl			Ethyl			S	s
Methoxy			I	tertButyl			iso-Propyl			S	σ <sub>.</sub>
Methoxy			I	tertButyl			Butyl			S	s
Methoxy			Ŧ	tertButyl			tertButyl			S	S
Methoxy			I	tertButyl			Phenyl			S	S
Methoxy			I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	S
4-C1-Phenoxy	ρχλ		I	tertButyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			S	S
4-C1-Phenoxy	o x y		I	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	-Phenyl		S	ഗ
4-C1-Phenoxy	оху		I	tertButyl	•		2-Pyridyl			S	S
4-C1-Phenoxy	oxy		r	tertButyl			Methyl			S	S
4-C1-Phenoxy	oxy		Ŧ	tertButyl			Ethyl			S	S
4-C1-Phenoxy	· kvo		I	tertButyl			iso-Propyl			S	ဟ

Phenyl  -Phenyl  -Phe	50 -	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
H tert.—Butyl Phenyl H tert.—Butyl Phenyl H tert.—Butyl Phenyl H tert.—Butyl H cyclo—Propyl			83	R4			R5			*	>
Phenyl  Phenyl  H tertButyl  Phenyl  H tertButyl  Phenyl  H tertButyl  H cyclo-Propyl							•				
H tertButyl H cyclo-Propyl	1-Phenoxy		I	tertButyl			Butyl			ח ו	n (
H tertButyl H cyclo-Propyl	-(C1, C1)-Pheny	_	I	tertButyl			tertButyl			S	S
-phenyl H tertButyl benyl H tertButyl benyl H tertButyl H cyclo-Propyl	-(C1_C1)-Phenv1		I	tertButyl			Phenyl			S	S
-phenyl H tertButyl + tert	-(C) (C) -beenv		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	s
-phenyl H tertButyl + tertButyl H cyclo-Propyl	-(C1 C1)-Pheny		<b>=</b>	tertButyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			S	S
-Phenyl H tertButyl H cyclo-Propyl	-(cl, cl) -Pheny	مينو ه	<b>.</b>	tertButyl			2, 4-(01,01)-	Phenyl		S	S
-phenyl H tertButyl H cyclo-Propyl	-(C1 C1)-Pheny		I	tertButyl			2-Pyridyl			S	s
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl H cyclo-Propyl	t-(C1, C1)-Pheny		I	tertButyl			Ethyl			S	S
H tertButyl  H tertButyl  H tertButyl  H tertButyl  H tertButyl  H cyclo-Propyl	[hienv]	1	Ξ	tertButyl			iso-Propyl			S	S
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl H cyclo-Propyl	Thieny]		I	tertButyl			Butyl			S	S
H tertButyl  H tertButyl  H tertButyl  H cyclo-Propyl	Thienv]		I	tertButyl			tertButyl			တ	S
H tertButyl  H cyclo-Propyl	Pvridvl		I	tertButyl			Phenyl			w.	S
H tertButyl H cyclo-Propyl	pvridvl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	S
H cyclo-Propyl	יקוייל		I	tertButyl			3-CF <sub>3</sub> -Pheny			s	S
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl Opyl H cyclo-Propyl Coply H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	. j. 163.		I	cyclo-Propyl			2, 4-(01,01)-	-Phenyl		S	S
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl Opyl H Cyclo-Propyl Toply H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl	1 Pr		<b>=</b>	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl Opyl H Cyclo-Propyl Opyl H Cyclo-Propyl Coply H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl	thy]		Ξ	cyclo-Propyl			Ethyl			S	S
Cyclo-Propyl	thvl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	s
H	+ h c 1		Ξ	cyclo-Propyl			Butyl			S	S
topyl H cyclo-Propyl cyclo-Propyl H cyclo-Propyl copyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	tny 1		<b>=</b>	cyclo-Propyl			tertButyl			S	S
opy)  oply  Cyclo-Propyl  opy)  H  Cyclo-Propyl  Cyclo-Propyl	+h]		I	cvclo-Propyl			Phenyl			S	S
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl	ciiji		: <b>:</b>	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	S
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl	o-rropji o-propji		<b>=</b>	cvclo-Propyl			3-CF <sub>3</sub> -Pheny	_		S	S
H CVC10-Propy1	0-Fronv]		I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)	-Phenyl		S	s
•	So-Propy		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
R1		R3	R4			R5			×	>	
iso-Propvl		I	cyclo-Propyl			Methyl			S	S	
iso-Propy]		I	cyclo-Propyl			Ethyl			ဟ	S	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	S	
racio-dian		I	cvclo-Propyl			Butyl			S	S	
cyclo-fropy:		<b>=</b>	cvclo-Propyl			tertButyl			S	S	
cyclo-Flops:		: <b>I</b>	cvclo-Propyl			Phenyl			S	S	
cyclo-Propyl		<b>.</b>	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	S	
cyclo-riopy:		: <b>:</b>	cyclo-Propyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			S	S	
cyclo-riopy:		: =	cvclo-Propvl			2, 4-(cl, cl)-Phenyl	henyl		S	S	
cyclo-Propyl		: I	cvclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S	
cyc10-r10py1		: 2	cvclo-Probyl			Methyl			S	s	
A1191		: I	cvclo-Propyl			Ethyl	•		S	S	
A11,1		: I	cvclo-Probvl			iso-Propyl			S	တ	
1,1,1		: I	cvclo-Propyl			Butyl			S	S	
A1131		: =	cvclo-Propvl			tertButyl			S	S	
A1136		: =	cvclo-Propyl			Phenyl			S	S	
Mothory		: <b>=</b>	cyclo-Propyl			Methyl			S	S	
Methoxy		<b>.</b>	cyclo-Propyl			Ethyl			S	S	
Mothoxy			cvclo-Propvl			iso-Propyl			S	S	
Methoxy		: 1	cvclo-Propvl			Butyl			S	S	
ACCIIOAY		: 3	cyclo-Propyl			tertButyl			S	S	
Methoxy		<b>E</b> :	cyclo riopy:			Dhony			S	S	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			riiciiyi				, <sub>U</sub>	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			n (	n o	
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			<i>o</i>	n (	
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Phenyl		S	S	

55	50	45	40	-	35	30	25	20	15	10	5	
2			R3	R4				R5			*	>
											·	·
4-C1-Phenoxy	2		I	cyclo-Propyl	ropy l			2-Pyridyl			n (	n (
VxOnede-17-4	· >		I	cyclo-Propyl	ropyl			Methyl			S	S
A-CI FRENCY	7 3		<b>.</b>	cvclo-Propyl	ropyl			Ethyl			S	s
4-CI-Fhenoxy	<b>,</b>		<b>.</b>	cvclo-Propyl	ropyl			iso-Propyl			S	S
V-CI-Fileno	7 3		: <b>=</b>	cyclo-Propyl	ropyl			Butyl			S	S
2 4-(C1 C1)	ر ۱-Phenv ا		=	cyclo-Propyl	ropyl			tertButyl			S	S
2 4-(01 01	)-Phenyl		×	cyclo-Propyl	ropyl			Phenyl			ဟ	S
2,4-(61,61	)-Pheny ]		I	cyclo-Propyl	ropyl			4-F-Phenyl			S	S
2 /- (01 )	)-Pheny		Ξ	cyclo-Propyl	ropyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			S	S
12 (12) -17 (	)-Phenvl		=	cyclo-Propyl	ropyl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl	henyl		S	S
2,4-(51,51	)-phenyl		<b>=</b>	cyclo-Propyl	ropyl			2-Pyridyl			S	S
2,4-(C1,C1)   neng:	1-Pheny		=	cyclo-Propyl	ropyl			Ethyl			S	S
2_Thieny]			Ξ	cyclo-Propyl	ropyl			iso-Propyl			S	S
2-Intenyl			Ï	cyclo-Propyl	ropyl			Butyl			S	S
2-Inienyi			Ξ.	cyclo-Propyl	ropyl			tertButyl			S	S
3-Pyridyl			: ==	cyclo-Propyl	ropyl			Phenyl			S	S
3-puridul			=	cyclo-Propyl	ropyl			4-F-Phenyl			S	S
3-buridul			Ŧ	cyclo-Propy	ropyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			S	S
5-r yr ruy r			x	tertButyl	3uty]			4-Hydroxy-2-butinyl	utinyl		0	0
Chior Chior			: =	tertButyl	3utyl			N=C(C2H5)2			0	0
			: I	tertButv	3utv]			N=C(cyclo-C3H5)2	15) 2		0	0
Calor			: 1	tertButvl	3utvl			2-Butanimino		•	0	0
Chlor			: 1	tertButvl	Sutv]			Cyclohexanimino	no		0	0
Chior			: =	tertButyl	Butyl			Cyclooctanimino	ou	•	0	0
Culor			: =	tort - Butv	[ n+ng			N=CH-C <sub>6</sub> Hs			0	0
Methyl			E	ים י	ם הראו							

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	ŭ	5	
R1		R3	R4			R5			×	>	1
		3	tertButvl			2-Furyl-methanimino	nanimino		0	0	
Mecny:		: 1	tertButvl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	) 2		0	0	
Methy:		: =	tertButyl			CH2CH2N+ (CH3)	3) 31-		0	0	
Mothyl		: I	tertButyl			CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>			0	0	
Mothy!		: =	tertButyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	٠		0	0	
Methy!		: =	tertButyl			CH2CH2CN			0	0	
deciny (		: =	tertButyl			CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>			0	0	
iso-propyi		: =	tertButyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Si (CH <sub>3</sub> ) 3	3)3		0	0	
150-propy1		: 3	tort -Butvl		•	CH,CH,O-N=C(CH3)	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0	
1so-propy1		= 3	tert -Butyl			CH, PO (0C, H5) 2	),		0	0	
1so-propy 1		: 3	+ort -Butvl			CH(CH <sub>3</sub> )CH(OCH <sub>3</sub> )	CH3) 2		0	0	
1so-propy 1		= =	tertButvl			CH2-CON(C2H5)2			0	0	
150-propy		: 3	+or+ -Butv1			Benzyl	ı		0	0	
1so-propy!		. 1	tert -Butyl			2,4-(C1,C1)-Benzyl	-Benzyl		0	0	
cyclo-Propy!		= =	+or+ -Butul			3-Pvridvl-methyl	ethyl		0	0	
cyclo-Propy!		E :	tont -Buty!			2-Thienvl-methyl	ethyl		0	0	
cyclo-Propy!		<b>.</b> 3	tert. Butyl			2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	thyl	0	0	
cyclo-Propy!		= =	tont Butul			2-Furanvl-methvl	ethvl	•	0	0	
cyclo-Propyl		<b>E</b> :	tertbutyl			2-Puridyl-methyl	lethv]		0	0	
cyclo-Propyl		I	tertButyı						•	•	
cyclo-Propyl		I	tertButyl			Pheny I			<b>&gt;</b> (	<b>)</b>	
Allvl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			0	0	
יונוא		I	tertButyl			4-Trifluorm	4-Trifluormethylphenyl		0	0	
A1131		: =	tertButyl			2-NO <sub>2</sub> -4-F-Pheny l	henyl		0	0	
A1191		: =	tertButyl			3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl	3)-Phenyl		0	0	
וואו	٠	: =	tertButvl			4-0CH <sub>3</sub> -Phenyl	ıyı .		0	0	
Allyl		:									

Allyl Allyl Ethinyl Ethinyl								
Allyl Allyl Ethinyl Ethinyl Ethinyl	R3	R4		RS		×	>	1
Allyl Allyl Ethinyl Ethinyl Ethinyl						•	c	
Allyl Ethinyl Ethinyl Ethinyl	I	tertButyl		4-OCF 3-Pheny I		>	<b>)</b>	
Allyl Ethinyl Ethinyl Ethinyl	=	tertButyl		4-NHCOCH <sub>3</sub> -Phenyl	lyl	0	0	
Ethinyl Ethinyl Ethinyl Ethinyl	: 3	tort -Butvl		2-Tetrahydropyranyl	ranyl	0	0	
Ethinyl Ethinyl Ethinyl	=	ייי פיייי פיייי		2_Tetrahydropyrany]	ranvl	0	0	
Ethinyl Ethinyl	ľ	tertButy!			. f	• •	• •	
Ethinyl	I	tertButyl		l-Benzotriazolyi	1 / 1	<b>•</b>	> 0	
כרוווולו	I	tertButyl		Methyl		0	>	
	. =	tert -Butvl		Ethy1		0	0	
Ethinyl	= :	ter to party !		n-Pronvl		0	0	
Ethinyl	<b>E</b>	tertbuty!		in Change		0	0	
Ethinyl	I	tertButyl		180-Propy I.		• •	•	
No thou	I	tertButyl		n-Butyl		>	<b>-</b>	
	I	tertButyl		iso-Butyl		•	•	
Methoxy	: =	tertRutvl		sekButyl		0	0	
Methoxy	: :	+on +on+		tertButyl		0	0	
Methoxy	E	rer tbuty i		[VYOH-OLOV		0	0	
Methoxy	I	tertButyl		cycle meny t	461	•	. •	
Methoxv	Ŧ	tertButyl		Cyclopropy Imetny i	tny i	<b>&gt;</b> (	> <	
Mothoxy	I	tertButyl		Ethoxymethyl		<b>5</b>	<b>&gt;</b>	
Actions	I	tertButyl		2-Methooxy-ethoxy-methyl	hoxy-methyl	0	0	
		tertButvl		<b>Benzyloxymethyl</b>	yl	0	0	
4-CI-FileHoAy	: 2	tort -Butvl		(4-Brombenzoyl)-methyl	l)-methyl	0	0	
4-C1-Phenoxy	<b>-</b>			(A-Mothoxvhenzov])-methv]	zovll-methvl	0	0	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl			£03.7 mt	• •	· c	
4-C1-Phenoxy	r	tertButyl		Phthalimidomethy	tny i	<b>)</b>	, (	
	Ξ	tertButyl		Methylthiomethyl	hyl	•	>	_
fvollallallat	: =	tort -Rutvl		2-Thiomethyl-ethyl	ethyl	0	0	_
4-C1-Phenoxy	= =	+or+ -Butvl		сн(с <sub>6</sub> н <sub>5</sub> ) соосн <sub>3</sub>	<u>.</u>	0	0	_
Phenylthio	E	i fano - 1 ea		Dhenvlethvl	,	0	0	_
Phenylthio	I	tertButyl		riiciij teviij i		1		

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	_	
R.1			R 3	R4			R5			×	-	
Pheny1thio			I	tertButyl			4-F-Phenylethyl	thyl		0	0	
Phenylthio	_		I	tertButyl			<b>Phthalimido</b>			0	0	
Phenylthio	_		±	tertButyl			<b>Tetrahydrophthalimido</b>	nthalimido		0	0	
Phenylthio			<b>=</b>	tertButyl			Maleinimido			0	0	
Phenylthio			Ŧ	tertButyl			Succinimido			0	0	
2.4-(C1.C1)-Pheny	)-Phenyl		I	tertButyl			Piperidino			0	0	
2, 4-(C1, C1	1)-Phenyl		I	tertButyl			Li <sup>+</sup>			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	1)-Phenyl		I	tertButyl			Na+			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	l)-Phenyl		Ŧ	tertButyl			K†			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	1)-Phenyl		Ŧ	tertButyl			NH <sup>4</sup> +			0	0	
2, 4-(Cl. Cl)-Pheny	1)-Phenyl		I	tertButyl			Diisopropylammonium	ammon i um		0	0	
2, 4-(c1, c1)	1)-Phenyl		I	tertButyl		٠	2-Hydroxyet	2-Hydroxyethyl-ammonium	æ	0	0	
2-Thienvl			I	tertButyl			Allyl			0	0	
2-Thienyl			I	tertButyl			Methallyl			0	0	
2-Thienvl			I	tertButyl			2-Chlorallyl			0	0	
2-Thienvl			I	tertButyl			Propargyl			0	0	
2-Thienvl			I	tertButyl			3-Iodpropargyl	gyl		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl			4-Hydroxy-2-butinyl	-butinyl		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl			N=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Chlor			x	cyclo-Propyl		•	N=C(cyclo-C3H5)2	3H5)2		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl			2-Butanimino	0		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl			Cyclohexanimino	mino		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl			Cyclooctanimino	mino		0	0	
Methyl			I	cyclo-Propyl			N=CH-C6H5			0	0	
Methyl			I	cyclo-Propyl			2-Furyl-methanimino	hanimino		0	0	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
R1			R3	R4		ů	R5			×	>
										c	c
Methyl			I	cyclo-Propyl			CH 2CH 2N (CH 3) 2	3/2		>	> '
Methyl			x	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N <sup>+</sup> (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> I	H <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> I <sup>-</sup>		0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>			0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1			0	0
Methyl			I	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN			0	0
iso-Propv]	-		Ξ	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>			0	0
iso-Proby			I	cyclo-Propyl			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S i (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	нз) з		0	0
iso-Propy			I	cyclo-Propyl			CH2CH20-N=C(CH3)2	С(СН3)2		0	0
iso-Pronv			I	cyclo-Propyl			CH2PO(0C2H5)2	5)2		0	0
iso-Propy]			I	cyclo-Propyl			сн(сн <sub>3</sub> )сн(осн <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	осн3) 2		0	0
iso-Propv			I	cyclo-Propyl			CH2-CON(C2H5)2	H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
iso-Propv			I	cyclo-Propyl			Benzyl			0	0
cvclo-Propvl	i		I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Benzy	)-Benzyl		0	0
Cvclo-Propv			I	cyclo-Propyl			3-Pyridyl-methyl	methyl		0	0
cvclo-Pro			I	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methyl	methyl		0	0
cyclo-Propyl	l val		I	cyclo-Propyl			2-Tetrahyd	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	fy l	0	0
cvclo-Pro	l va		Ι	cyclo-Propyl			2-Furanyl-methyl	methy1		0	0
cvclo-Propyl	l you		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	methyl		0	0
cvclo-Propv			I	cyclo-Propyl			Phenyl			0	0
4) 1v1			I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	0
			I	cyclo-Propyl			4-Trifluor	4-Trifluormethylphenyl		0	0
יליוא			I	cyclo-Propyl	•		2-N0 <sub>2</sub> -4-F-Pheny	-Phenyl		0	0
A11v1			I	cyclo-Propyl			3, 5- (CF 3, C	3, 5- (CF 3, CF 3)-Phenyl		0	0
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	eny l		0	0
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-OCF 3-Pheny l	any l		0	0

	R3	R4		RS			×	>
	I	cvclo-Propyl		4-NHCOCH <sub>3</sub> -Phenyl	ıenyl		0	0
	: <b>1</b>	cvclo-Probyl		2-Tetrahydropyranyl	pyranyl		0	0
	: I	cvclo-Propvl		2-Tetrahydropyranyl	pyranyl		0	0
	: I	cvclo-Probyl		1-Benzotriazolyl	colyl		0	0
	: 1	cvclo-Propyl		Methyl			0	0
	: <b>I</b>	cyclo-Propyl		Ethyl			0	0
	<b>=</b>	cyclo-Propyl		n-Propyl			0	0
	: <b>I</b>	cyclo-Propyl		iso-Propyl			0	0
	I	cyclo-Propyl		n-Butyl			0	0
	<b>x</b>	cyclo-Propyl		iso-Butyl			0	0
	I	cyclo-Propyl		sekButyl		•	0	0
	I	cyclo-Propyl		tertButyl			0	0
	I	cyclo-Propyl		cyclo-Hexyl			0	0
	Í	cyclo-Propyl		<b>Cyclopropylmethyl</b>	methyl		0	0
	I	cyclo-Propyl		Ethoxymethyl	_		0	<b>o</b> .
A-C1-Phenoxy	I	cyclo-Propyl	-	2-Methoxy-e	2-Methoxy-ethoxy-methyl		0	0
4-C1-Phenoxy	I	cyclo-Propyl		<b>Benzyloxymethyl</b>	thyl		0	0
/ CI - Dhenoxy	I	cyclo-Propyl		(4-Brompenz	(4-Brombenzoxyl)-methyl	_	0	0
	I	cvclo-Propyl		(4-Methoxyb	(4-Methoxybenzoxyl)-methyl	thyl	0	0
4-CI-rilenoxy	: <b>I</b>	cyclo-Propyl		<b>Phthalimidomethyl</b>	methyl		0	0
t-cl ruchoxy	1	cvclo-Propyl		Methylthiomethyl	ethyl		0	0
4-CI-rienoxy	Ξ	cvclo-Propyl		2-Thiomethyl-ethyl	l-ethyl		0	0
4-c1-riellony bhonilthio	: <b>1</b>	cyclo-Propyl		сн(сен5)соосн3	CH <sub>3</sub>		0	0
Fineny Linio Phenvlthio	<b>.</b>	cyclo-Propyl		Phenylethyl			0	0
Phenylthio	<b>.</b>	cyclo-Propyl		4-F-Phenylethyl	thyl		0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5		
R1			R3	R4				R5			×	-	
Dhenv1+hio			I	cyclo-Propyl	opyl			Phthalimido			0	0	
phenylthio			<b>.</b>	cyclo-Propy	lydo			<b>Tetrahydrophthalimido</b>	thalimido		0	0	
Phenylthio			×	cyclo-Propy	opyl			Maleinimido			0	0	
Phenylthio			I	cyclo-Propy	opyl			Succinimido			0	0	
2.4-(C1.C)	)-Phenyl		Ŧ	cyclo-Propy	opy 1			Piperidino			0	0	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	)-Phenyl		I	cyclo-Propy	opyl			Li+			0	0	
2. 4-(C1, C1	)-Phenyl		I	cyclo-Propyl	opyl			Na+			0	0	
2, 4-(C1, C1	)-Phenyl		I	cyclo-Propyl	opyl			+ +			0	0	
2, 4-(C1, C1	)-Phenyl		I	cyclo-Propy	opyl			NH¢+			0	0	
2, 4-(c1, c1	)-Phenyl		I	cyclo-Propy	opyl			Diisopropylammonium	mmon i um		0	0	
2,4-(C1,C1	)-Phenyl		I	cyclo-Propyl	opyl			2-Hydroxyet	2-Hydroxyethyl-ammonium		0	0	
2-Thienvl			I	cyclo-Propyl	opyl			Allyl			0	0	
2-Thienvl			I	cyclo-Propy	opy l			Methallyl			0	0	
2-Thienvl			I	cyclo-Propy	opyl			2-Chlorallyl			0	0	
2-Thienvl			Ξ	cyclo-Propy	'opy1			Propargyl			0	0	
2-Thienvi			I	cyclo-Propy	l ydo,			3-Iodpropargyl	Jyl		0	0	
			I	tertButy	ıtyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
։ և			I	tertButyl	ıtyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
. 2			I	tertButy	ıtyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Mothv1			I	tertButyl	ıtyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Ethul			Ξ	tertButy	ıtyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
n-Propv]			Ŧ	tertButy	utyl	-		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
ico-propy)	_		<b>=</b>	tertButy	utyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
130 11 0FJ	•		I	tertButy	utyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
iso-Butvl			Ŧ	tertButy]	utyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
. 7. 5.					•								

50 55	45	40	35 40	30	25	20	15	10	5	e	
R1		R3	R4			R5			×	-	I
			12410- +40+			-N=C (CH <sub>2</sub> ) 2			0	0	
SekButyl		E 3	+on+ -Butx1			-N=C (CH3) 3			0	0	
tertButy!		<b>E</b> :	reftbucy i			N=C(CH3)2			0	0	
cyclo-Propyl		I	tertButy!			-N-C(cm3) 2			•	•	
cyclo-Butyl		Ŧ	tertButyl			-N=C (CH3) 2			>	Э .	
cvclo-Pentyl		I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
cvclo-Hexvl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
cvclo-Heptyl		x	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
cyclo mcr_j c		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
1-Methylcyclopropyl	propyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
rrifluormethyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Chlordifluormethyl	lethyl	I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Pentafluorethyl	, l w	I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
i so-Propoxv		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Methoxymethyl		I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
1-Methvlmethoxvmethvl	xvmethvl	I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
1-Methylmethoxyethyl	xyethyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Ethoxymethyl	•	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Vinvl		I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
A)1v1		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Methallvl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
recircity.		Ξ	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
crosj: Fthinvl		Ξ.	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Property :		x	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Phenylethinyl	,,,,,	I	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Methoxv		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
7											

5	×		0	0	0	0	0	0	0	0		o c		_	0	0	0	0	0	0	0	0	0			0	0	0	0	
10																														
15			7	7			<b>,</b>	<b>,</b>	, ,	7	2	7	7	7	7	2	7				7 -	, ,	· ·	7	7	) 2	) 2	,	• -	7 /
20	R5		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C (CH3)	-N=C(CH1)	-N=C (CH3)	(CH3)	(CH2) )=N=	* (*H2) 2-N-	(CH3)	-N=( cu3)	-N=C(CH3)2	-N=C(CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH <sub>3</sub> )	-N=C(CH3)	(CH) J=N=	-N=C(CH <sub>2</sub> )	-N=C (CH <sub>3</sub> )	TENDY OF M	-N=( CH3	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3	-N=C (CH3)	(CHJ) JINI	C ) ,
25																														
30											_		_	_					<b>.</b>				<b>.</b>	_	-	-			_ ,	_
35	· •		tertButvl	bert -Riity)		tertbuty	tertButyl	tertbuty	tertButyl	tertButy	tertButy]	tertButyl	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tert -Butv]	tort -Butv]	tentbuty	rei t buty	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButv	+or+ -Bilty	+ + + + + + + + + + + + + + + + + + +	tertbucy	tertButy
40	23		1		= =	r ·	<b>=</b> :	±	I	I	I	I	I	I	: =	: 1	: 3	E 3	<b>E</b> :	E	I :	I	<b>x</b>	<b>#</b>	I	7	: :	E :	I	I
45							hio			enoxy					5			•	eny l				Pheny l	s, CH3)-Pheny				3)-Pnenyı		
50				oxy	Trifluormetnoxy	Methylthio	fluormethylt	Phenoxy	1-Phenoxy	-(c1, c1)-Ph€	4-CF 3-Phenoxy	Phenyl	-Phenylthio	3_E_bhanvl	-Filenyı (r. r.) obon	2, 4-(r, r)-rueny 1	: I -Pneny I	3-C1-Phenyl	4-(c1, c1)-Ph	CH3-Phenyl	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub> -Phenyl	2, 4- (CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> ) -Pheny l	4. 6- (CH3, CH3	CE bhanvl	2-cr3-rilengi	OCH 3-Pneny 1	2, 4-(OCH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> )-Pneny 1	4-OCF 3-Phenyl	4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl
55	7	2		ETHOXY	T	Met	T	Phe	7-7	2,4	7-t	Phe	7-6	. נ	ָר ,	7,7	7-7	Ä.	2,	7-(	m F	<b>1</b>	7,	2	<u>.</u>	7	-7	2,	4-	4

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
7		9	3			5 &			×	>	
74		2	. 4								1
3-SCF <sub>3</sub> -Phenyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	Phenyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	•	Ξ	tertButyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
2-Thienyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
3-Thienyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
2-Furanyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Furanyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
2-Tetrahydrofurany	ranyl	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
3-Tetrahydrofurany	ranyl	x	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
2-Pyridyl		I	tertButyl	-		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
3-Pyridyl		I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
4-Pyridyl	•	×	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Tetrahydropyrany	ranyl	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
3-Tetrahydropyrany	ranyl	I	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
4-Tetrahydropyrany	ranyl	Ξ	tertButyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
<b>.</b>	•	I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
<b>L</b>		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
cı		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Methyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Ethyl		<b>±</b>	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
n-Propyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			0	0	
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			$-N=C(CH_3)_2$			0	0	
n-Butyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
iso-Butyl		Ξ	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
sekButyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
								•			,	>
21			R3	R4				R5			<	-
			=	[waoad_ofono	[hao			-N=C(CH3),			0	. •
tertbutyl	cy I		<b>:</b> :		. [40]			-N=C(CH3)			0	0
cyclo-Pro	opy l		E	cyc10-rropy	obyt			2 (cii3) 2 ::			• •	•
cyclo-Butyl	tyl		x	cyclo-Propyl	.ob)l			-N=C(CH3)2			<b>)</b>	<b>-</b> (
cyclo-Pentyl	ntyl		I	cyclo-Propyl	. obyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			•	0
cvclo-Hexvl	xv1		I	cyclo-Propy	.obyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
cvclo-Hentyl	otv1		I	cyclo-Propy	'opyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Octvl	- C-+		I	cyclo-Propy	'opy]			-N=C (CH3) 2			0	0
1-Methv1	Jere dely.		I	cyclo-Propy	lydo			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Trifluormethy]	methvl		I	cyclo-Propy	lydo			-N=C (CH3) 2			0	0
chlordif	chlordifluormethyl		I	cyclo-Propy	ropy l			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Pentafluorethyl	orethyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			•	0
i so-Propoxy	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,		Ŧ	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Methoxymethyl	ethvl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
1-Methy]	1-Methylmethoxymethyl	~	I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
1-Methyl	-Methylmethoxyethyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C(CH3)2			0	0
E+hoxvmethvl	thvl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
vinvl			I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
. j			Ŧ	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Mothally	-		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
recital ty	<u>.</u>		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
C1 OCJ 1		•	Ξ	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Contract	ς,		<b>. .</b>	cvclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Propalgy:	y. Phinel		=	cvclo-Propy	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Mothoxy			I	cyclo-Propyl	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Ethoxy			Ŧ	cyclo-Propyl	ropyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
•												

	R 3	4		RS		*	>
	=			-N=C(CH3),		0	0
	= 3	cyclo-ropy		-N=C(CH3)2		0	0
Metnyltnio	<b>E</b> 3	cyclo-riopy		-N=C (CH3) 3		0	0
Trifluormethyltnio	= :	cyclo-rropy		-N=C(CH3)2		0	0
Phenoxy	<b>E</b> :	cyclo-Propy		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
4-C1-Phenoxy	<b>:</b> :	cyclo-Propy		-N=C(CH3)2-N-		0	0
2, 4-(C1, C1)-Phenoxy	<b>E</b> :	cyclo-rropy:		-N=C(CH <sub>2</sub> ),		0	0
4-CF <sub>3</sub> -Phenoxy	<b>E</b> :	cyclo-rropy		-N=C(CH <sub>2</sub> )		0	0
Phenyl	I	cyc 10-Propy		-N-c(cit3) 2		• •	
2-F-Phenylthio	x	cyclo-Propy		-N=C(CH3)2		<b>o</b> (	<b>)</b>
3-F-Phenyl	I	cyclo-Propy		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
F.F.J-Phenyl	I	cyclo-Propy	_	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
2-C1-Phenv1	I	cyclo-Propy		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
Phenyl	×	cyclo-Propy		-N=C(CH3)2		0	0
2.4-(Cl.Cl)-Phenyl	I	cyclo-Propyl	_	-N=C (CH3) 2		0	0
2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propyl	_	-N=C(CH3)2		0	0
3-CH <sub>2</sub> -Phenvl	I	cyclo-Propyl		-N=C (CH3) 2		0	0
-Phenyl	I	cyclo-Propyl	,	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	•	0	0
2. 4- (CH <sub>3</sub> . CH <sub>3</sub> ) -Phenyl	I	cyclo-Propyl	_	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
2 4 6-(CH2, CH2)-Phenyl	I	cyclo-Propyl	_	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
2, 4, 0 (Clist Clist Clist)	I	cyclo-Propyl		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
2-013 :	I	cyclo-Propy		-N=C (CH3) 2		0	0
2	I	cyclo-Propy		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
4-00F Pheny	I	cyclo-Propy	-	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
4-SCH <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propy	1	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0
3-SCF <sub>3</sub> -Phenyl	I	cyclo-Propy	_	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0

50	45	40		35	30	25	20 ග	15	10	×	5
		R3	R4				Z.				
[vaodo_1.0kg.vv]		3	cvclo-Propvl	ropvl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2, 4-(NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> ) -rueny t		: 3	cvclo-Propvl	ropvi			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
32-Pheny I		= =	01010	. (40			-N=C(CH3),			0	0
2-Thienyl		Ξ.	cyclo-rropy	ı opyı			2 (5::2) 2 H			0	0
3-Thienyl		I	cyclo-Propy	ropy!			_N=C(CH3)2			0	0
2-Furanyl		I	cyclo-Propy	ropy I			-N=C(CH3)2			0	0
3-Furanyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N-C(CH3)2			0	0
etrahydropfuranyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C(CH3) 2			) C	· c
3-Tetrahydrofuranyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C(CH3)2			· c	· c
2-Pyridyl		Ŧ	cyclo-Propy	ropyl			-N=C(CH3)2			<b>o</b> c	· ·
3-Pyridyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C(CH3)2			<b>o</b> (	<b>.</b>
4-Pvridvl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			Э (	<b>&gt;</b> (
2-Tetrahydrobyranyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0 (
3-Tetrahydronyranyl		I	cyclo-Propy	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
ect any dropy any .		<b>=</b>	cvclo-Proby	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
4-letranydropyramy i		: 3	Mothul				I			0	0
Chlor		<b>E</b> 3	repril				I			0	0
Chlor		ב :	E UII Y	•			: 1			0	0
Chlor		I	n-Propy i				: 3			0	0
Chlor		I	i so-Propy i	ı fdo			= =			C	0
Chlor		I	n-Butyl				<b>:</b>			• •	· c
Chlor		±	iso-Butyl	tyl			Ī			<b>O</b>	•
Mo+hv1		I	sekButy	utyl			Ŧ			<b>o</b>	o :
		I	n-Pentyl	۲,			Ŧ			0	0
Me city i		<b>.</b>	2-Pentv	. ~			I			0	0
Metnyl		: 3	3-Penty				I			0	0
Methyl		<b>E</b>					3			0	0
Methyl		I	n-Hexyl				=			1	

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	3	5	
R1		R3	R4			RS			×	>	- 1
						;			ď	•	
Methyl		I	2-Hexyl			<b>=</b>			>	>	
iso-Propv1		I	3-Hexyl			Ŧ			0	0	
iso-Propyl		I	2-Methyl-2-pentyl	pentyl		I			0	0	
isa-Propyl		I	cyclo-Propylmethyl	lmethyl		I			0	0	
iso-Propvl		I	cyclo-Butyl	•		Ŧ			0	0	
iso-Propyl		I	cyclo-Pentyl	_		I			0	0	
iso-Propyl		Ŧ	cyclo-Hexyl			I			0	0	
cvclo-Propvl		=	1-Methylcyclohexyl	lohexyl		<b>=</b>			0	0	
cyclo-Probyl		I	3-Trifluorm	3-Trifluormethylcyclohexyl		I			0	0	
cyclo-Propyl		I	Allyl	•		I			0	0	
cyclo-Propyl		Ŧ	1-Buten-3-yl			Ŧ			0	0	
cvclo-Propyl		Ŧ	Crotyl			I			0	0	
cvclo-Propyl		I	Propargyl			I			0	0	
Allyl		I	1-Butin-3-yl	_		Ŧ			0	0	
Allyl		Ξ	3-Methyl-1-butin-3-y	butin-3-yl		I			0	<b>o</b> _	
Allyl		I	2-Pentin-4-yl	y		Ŧ		•	0	0	
A11v1		I	Benzyl			I			0	0	
A11v1		I	2-Phenylethyl	yl		I			0	0	
ly I A		I	2-Methylthioethyl	oethyl		I			0	0	
Ethinvl		I	2-Chlorethyl	-		I			0	0	
Ethiny!		Ξ	2-Methoxyethyl	hyl		I			0	0	
Ethiny!		I	2-(N, N-Dime	2-(N, N-Dimethylamino)ethyl		Ŧ			0	0	
Ethiny!		I	Phenyl			I			0	0	
Ethinv]		I	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	=		I			0	0	
Ethinyl		I	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	-		I			0	0	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	<b>5</b>	
						Ī					
RI			۳3 ع	R4		82				×	_
2-Thienyl			I	3-Tetrahydrofuranyl	anyl	I				0	0
2-Thienyl			I	4-Tetrahydrofuranyl	anyl	I				0	0
2-Thienyl			I	2-Thiazolyl		I				0	0
2-Thienyl			I	5-CH <sub>3</sub> -2-Thiazolyl	yl	I				0	0
2-Thienyl			I	4-CH <sub>3</sub> -5-COOH-2-Thiazolyl	Thiazolyl	I				0	0
3-Pyridyl			I	Methyl		I				0	0
3-Pyridyl			I	Ethyl		I				0	0
3-Pyridyl			I	n-Propyl		I				0	0
3-Pyridyl			I	iso-Propyl		<b>=</b>				0	0
3-Pyridyl			I	n-Butyl		I				0	0
3-Pyridyl			Ŧ	iso-Butyl		I				0	0
iso-Propyl				sekButyl		I				0	0
iso-Propyl			Methyl	n-Pentyl		I				0	0
iso-Propyl				2-Pentyl		I				0	0
iso-Pentyl			Methyl	3-Pentyl		I				0	0
iso-Propyl				n-Hexyl		I				0	0
iso-Propyl				2-Hexyl		Ĭ				0	0
iso-Propyl			Methyl	3-неху1		Ξ				0	0
Chlor			I	Methyl		T	-N=C(CH3) <sub>2</sub>			0	0
Chlor			I	Ethyl		T	-N=C(CH3)2			0	0
Chlor			I	n-Propyl		Τ	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Chlor			Ŧ	iso-Propyl		T	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Chlor			I	n-Butyl		T	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Chlor			Ŧ	iso-Butyl		7	-N=C (CH3) 2			0	0
Methyl			I	sekButyl		T	-N=C (CH3) 2			0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	·	5	
								ų. I			>	>	
R1			23	R4				R2			<	-	
			3	- Donte	_			-N=C(CH1),			0	0	
Metnyl			: 3	2-Penty				-N=C(CH <sub>3</sub> ) 2			0	0	
Metny I			: :	3-Donty				-N=C(CH <sub>2</sub> )			0	0	
Methyl			= 1	n-Hexv]				-N=C(CH <sub>1</sub> ) 2			0	0	
Methy!			= 3	2-Hexy				-N=C (CH <sub>2</sub> ) 2			0	0	
Metny i			: I	3-Hexv				-N=C(CH <sub>3</sub> ) 2			0	0	
1 SO-Propy			: =	2-Methy	2-Methvl-2-nentvl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
1so-Propy	_ ,		: =	- 01272	cvelo-Propylmethyl	سو		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
1so-Propy			: =	cyclo-Buty]	utv]			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
150-Propy			: 3	cyclo-Pentyl	entvl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
top-propy			: I	cvclo-Hexvl	exvl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Cuclo-Bronul			=	1-Methy	1-Methylcyclohexyl	-		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
Cyclo-Propy			Ŧ	3-Trifi	3-Trifluormethylcyclohexyl	:yclohexyl		-N=C (CH3) 2			0	0	
cyclo-Propy			Ι	Allyl	,			-N=C (CH3) 2			0	<b>o</b> .	
cyclo-ric	, p.y.		<b>=</b>	1-Buten-3-yl	1-3-41			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
	164		: 1	Crotyl				-N=C (CH3) 2			0	0	
cyclo-Fropyl	ונקי ואמי		<b>=</b>	Propargyl	-			-N=C(CH3)2			0	0	
6)240			<b>=</b>	1-Butin-3-yl	1-3-y1			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
1111			I	3-Methy	3-Methyl-1-butin-3-yl	-3-y1		-N=C (CH3) 2			0	0	
1111			I	2-Pent	2-Pentin-4-yl			-N=C (CH3) 2			0	0	
A1151			<b>=</b>	Benzyl	•			-N=C (CH3) 2			0	0	
A1131			<b>=</b>	2-Phen	2-Phenylethyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
A1131			<b>=</b>	2-Meth	2-Methylthioethyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Ally I			I	2-Chlorethyl	rethyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Ethinyl Ethinyl			I	2-Meth	2-Methoxyethyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0	
•													

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
R1	R3	8 R4				R5			×	>
Ethinyl	I	2-(N,	2-(N,N-Dimethylamino)-ethyl	mino)-ethyl		-N=C (CH3) 2			0	0
Ethinyl	I	Phenyl	_			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Ethinyl	I	2-CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Ethinyl	<b>±</b>	4-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -Pheny1			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Methoxv	Ξ	2, 4-(	2, 4-(CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> )-Pheny	enyl		-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Methoxy	<b>=</b>	2, 3, 5	2, 3, 5- (CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> , CH <sub>3</sub> ) -Phenyl	H <sub>3</sub> )-Phenyl		-N=C (CH3) 2			0	0
Methoxy	Ŧ	3-CF	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Methoxy	<b>=</b>	3-F-P	3-F-Phenyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Methoxy	I	2-c1-	2-C1-Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Methoxy	I	4-c1-	4-C1-Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
4-C1-Phenoxy	I	2, 4-(	2, 4-(F, F)-Phenyl			-N=C(CH3)2			0	0
4-C1-Phenoxy	I	2, 3,	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Phenyl	-Phenyl		-N=C(CH3)2			0	0
4-C1-Phenoxy	Ξ	7-CN-	2-CN-Pheny l			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
4-C1-Phenoxy	I	2-0CF	2-0CH <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
4-C1-Phenoxy	r	2, 3-	2, 3-(OCH3, OCH3)-Phenyl	Phenyl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
4-C1-Phenoxy	Ĭ	3,4,5	3, 4, 5- (0CH <sub>3</sub> , 0CH <sub>3</sub> , 0CH <sub>3</sub> )-Pheny	, och3)-Phen	71	-N=C(CH3)2			0	0
Phenylthio	Ξ	3-00	3-0CF <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Phenylthio	I	100-ty	4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> -Phenyl	<u></u>		-N=C(CH3)2			0	0
Phenylthio	<b>=</b>	2-SCI	2-SCH <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Phenylthio	Ξ	2,4-	2, 4-(SCH3, SCH3)-Pheny	Phenyl		-N=C(CH3)2			0	0
Phenylthio	I	2-SCI	2-SCF <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C(CH3)2			0	0
Phenylthio	I	4-NO	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2. 4-(C1. C1)-Pheny	Ξ.	2, 4-	2, 4- (NO <sub>2</sub> , NO <sub>2</sub> )-Phenyl	ienyl		-N=C (CH3) 2			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	H A)	2-CH	2-CHO-Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2,4-(C1,C1)-Pheny	y. H	3-00	3-COCH <sub>3</sub> -Phenyl			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
								r G			×	>
R1			83	π¢				e e				
			3	1-roce bhonu	Lynahd			-N=C(CH3),			0	0
2, 4-(CI, CI)-Pneny i	l)-Pnenyı		- ·	- C - C - C - C - C - C - C - C - C - C	i filoli i			2 (CHJ) J-N-			0	0
2, 4-(C1, C)	l)-Phenyl		I	l-Naphtny I				-N-c(cu3) 2			,	, (
2, 4-(Cl. Cl)-Phenyl	1)-Phenyl		I	2-Naphthyl	yl			-N=C(CH3)2			>	>
2_thiony			=	Piperidino	2			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2 Thionyl			; 3	3-Tetrah	3-Tetrahydrofurany	ny l		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2-inienyi			: =	4-Tetrah	4-Tetrahydrobyrany	ואו		-N=C(CH3)2			0	0
2-inienyt			: =	2-Thiazolvl	1 1	,		-N=C(CH3)2			0	0
2-Intenyt			: 1	5-CH 3-2-	5-CH 2-Thiazolv]	-		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2-intenyi			: =	4-CH3-5-	6-CH3-5-COOH-2-Thiazoly]	hiazolvl		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2-Inteny			: 1	Methyl				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
2 Puridul			: 1	Fthv				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
3-Pyridy (			: =	n-Propyl		-		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
3-Pyriuy			: I	iso-Probv	~ *			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
3-ryriuyi			: =	n-Rutvl				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
3 punidul			: 1	iso-Butvl	_			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	<b>.</b>
i co-Brond			Methvl	sekButvl	E V 1			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
Edo In-Dei			Methyl	n-Pentvl	۰			-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
iso-Propy			Methyl	2-Penty				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
150-Propv]	_ =		Methyl	3-Pentyl				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
tgo-b-ost	<u>.</u>		Methyl	n-Hexv1				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
[do:1-05]			Methyl	2-Hexv]				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
SO-Propy			Methyl	3-Hexvl				-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			0	0
130-1105			:	tertButv	utvl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Phenyl		0	S
Metnyl			: 3	tert -Butvl	======================================			2-Pyridyl			0	S
Methyl			= =	40.4				Ethyl			0	S
Methyl			E	rer tbuty	ury:							

55	50	45	40	35	30	25		20	15	10	5	_	
R1			R3	R4			R5				×	-	
Methyl			I	tertButyl			iso-	iso-Propy1			0	S	
Methyl			I	tertButyl			Butyl	_			0	S	
Methyl			I	tertButyl			tert	tertButyl			0	S	
Methyl			I	tertButyl	•		Phenyl	ıyı			0	S	
iso-Propy			I	tertButyl			4-F-	4-F-Pheny l			0	S	
iso-Propy			I	tertButyl			3-0	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
iso-Propy			I	tertButyl			2,4-	2, 4-(C1, C1)-Phenyl	enyl		0	တ	
iso-Propyl			I	tertButyl			2-P	2-Pyridy1			0	S	
iso-Propyl	1		×	tertButyl			Methyl	ıyl			0	S	
iso-Propy			I	tertButyl			Ethy1				0	ഗ	
iso-propy	_		I	tertButyl			iso-	iso-Propyl			0	S	
cyclo-Propyl	pyl		I	tertButyl			Butyl	=			0	S	
cyclo-Pro	pyl		I	tertButyl			teri	tertButyl			0	S	
cyclo-Proply	ply		¥	tertButyl			Pheny l	lyl			0	S	
cyclo-Propyl	pyl		I	tertButyl			4-F	4-F-Phenyl			0	S	
cyclo-Propy	lyd		I	tertButyl			3-CI	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
cyclo-Propyl	pyl		x	tertButyl			2,4-	2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	nenyl		0	S	
cyclo-Propyl	pyl		I	tertButyl			2-P.	2-Pyridyl			0	S	
Allyl			I	tertButyl			Methy 1	ıy l			0	S	
Allyl			x	tertButyl			Ethy1	=			0	S	
Allyl			I	tertButyl			iso	iso-Propyl			0	σ.	
Allyl			¥	tertButyl			Butyl	11			0	S	
Allyl			I	tertButyl			teri	tertButyl	<i>:</i>		0	S	
Allyl			I	tertButyl			Phenyl	nyl			0	S	
Methoxy			I	tertButyl			Methyl	hy l			0	S	

R1	R3	84		R5		×	>	1
Methoxy	I	tertButyl		Ethyl		0	S	
Methoxy	Ŧ	tertButyl		iso-Propyl		0	S	
Methoxy	I	tertButyl		Butyl		0	S	
Methoxy	I	tertButyl	•	tertButyl		0	S	
Methoxy	x	tertButyl		Phenyl		0	ဟ	
Methoxy	I	tertButyl		4-F-Phenyl		0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		3-CF <sub>3</sub> -Phenyl		0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl	•	2, 4- (C1, C1)-Phenyl	enyl	0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		2-Pyridy1		0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		Methyl		0	S	
4-C1-Phenoxy	Ŧ	tertButyl		Ethyl		0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		iso-Propyl		0	S	
4-C1-Phenoxy	I	tertButyl		Butyl		0	S	
2, 4-(Cl. Cl)-Phenyl	Ė	tertButyl		tertButyl		0	S	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	Ξ	tertButyl		Phenyl		0	S	
2 4-(Cl. Cl)-Phenyl	<b>.</b>	tertButyl		4-F-Phenyl		0	S	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	I	tertButyl		3-CF <sub>3</sub> -Phenyl		0	S	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	x	tertButyl		2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	lenyl	0	S	
2 4-(Cl. Cl)-Phenyl	Ξ	tertButyl		2-Pyridyl		0	S	
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	<b>=</b>	tertButyl		· Ethyl		0	S	
2_Thienv]	I	tertButyl		iso-Propyl		0	S	
2-Thienvl	I	tertButyl		Butyl		0	S	
2-Thienvl	I	tertButyl		tertButyl		0	S	
3-Pvridvl	I	tertButyl		Pheny l		0	S	
3-Pyridyl	I	tertButyl		4-F-Pheny l		0	S	

55	50	45	40		35	30	25		20	15	10	5	_	
			ć					c L				<b>&gt;</b>	>	
RI			2	*				2					-	1
3-Pyridyl			I	tertButyl	tyl			3-CF	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
Methyl			I	cyclo-Propyl	opyl			2, 4-	2, 4-(cl, cl)-Phenyl	henyl		0	S	
Methyl			I	cyclo-Propy	opyl			2-Pyridyl	idyl			0	S	
Methyl			I	cyclo-Propyl	opyl			Ethyl				0	S	
Methyl			I	cyclo-Propy	opyl			iso-f	iso-Propyl			0	S	
Methyl			I	cyclo-Propyl	opyl			Butyl				0	S	
Methyl			I	cyclo-Propyl	opyl			tert	tertButyl			0	S	
Methyl			I	cyclo-Propy	opyl		-	Pheny l				0	S	
iso-Propvl			I	cyclo-Propy	opy 1			4-F-I	4-F-Phenyl			0	S	
iso-Propyl			x	cyclo-Propy	opyl			3-CF	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
iso-Propyl			I	cyclo-Propy	opyl			2, 4-	2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		0	S	
iso-Propyl			I	cyclo-Propy	opyl			2-Py	2-Pyridyl			0	S	
iso-Propyl			I	cyclo-Propy	opyl			Methyl	1			0	S	
iso-Propyl			I	cyclo-Propy	opyl			<b>Ethy</b> l	_			0	S	
iso-Propyl			I	cyclo-Propy	opyl			i so-	iso-Propyl			0	σ.	
cyclo-Propyl	y.		I	cyclo-Propyl	opy l			Butyl	_			0	S	
cyclo-Propy	, lk		I	cyclo-Propyl	opyl			tert	tertButyl			0	S	
cyclo-Propy	y		Ŧ	cyclo-Propyl	opyl			Phenyl	۲,			0	S	
cyclo-Propy	الأ		I	cyclo-Propyl	opyl			4-F-	4-F-Phenyl			0	S	
cyclo-Propyl	۱۸		I	cyclo-Propyl	opyl			3-CF	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
cvclo-Propy	, <sub>-</sub>		I	cyclo-Propy	opyl			2,4-	2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		0	S	
cvclo-Propy	, <u>-</u>		I	cyclo-Propy	opyl			2-Py	2-Pyridyl			0	S	
Allvl	,		I	cyclo-Propy	opy l			Methyl	y l			0	S	
Allyl			I	cyclo-Propy	opyl			Ethy l				0	S	
Allyl			I	cyclo-Propyl	opyl			i so-	iso-Propyl			0	ဟ	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
5			83	<b>,</b>			87 25			×	>	
11101			Ξ	cyclo-Propyl			Butyl			0	S	
1111			<b>=</b>	cvclo-Probyl			tertButyl			0	S	
1111			: =	cyclo-Probyl			Phenyl			0	S	
Mothoxy			: <b>=</b>	cyclo-Propyl			Methyl			0	S	
Mothoxy			Ξ.	cyclo-Propyl			Ethyl			0	S	
Mothoxy			<b>=</b>	cyclo-Propyl			iso-Propyl			0	S	
Total of			<b>.</b>	cyclo-Propyl			Butyl			0	S	
Mothoxy			· : <b>=</b>	cyclo-Propyl			tertButyl			0	S	
Mothoxy			<b>.</b>	cyclo-Propyl			Phenyl			0	S	
Hothox			: <b>=</b>	cyclo-Propyl			4-F-Pheny l			0	S	
Actions	220		: <b>=</b>	cvclo-Propyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
4-C1-Filenoxy	ienoxy		: =	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Pheny l		0	S	
4-C1-Phenoxy	lenox.v		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			0	S	
V=Cl -Phenoxy	enox.		I	cyclo-Propyl			Methyl			0	S	
expured-[J-7	y x Ou et		Ξ	cyclo-Propyl			Ethyl			0	S	
Axoned-[J-7	henoxv		Ξ	cyclo-Propyl			iso-Propyl			0	S	
4-C1-Phenoxy	henoxy		I	cyclo-Propyl			Butyl			0	S	
2 4-(C)	2 4-(C) C))-Pheny		Ξ	cyclo-Propyl			tertButyl			0	S	
2 4-(5)	1, C1) -Phenvl		I	cyclo-Propyl			Phenyl			0	S	
2) 47	2,4 (Cl, Cl) -Phenyl		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	S	
2) 1/2	1, Cl)-Phenyl		I	cvclo-Propyl			3-CF <sub>3</sub> -Phenyl			0	S	
2) - 1 - 7	2,4 (Cl, Cl) -Phenyl		I	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	Pheny l		0	S	
2) - 4 ' 7	z,4-(cl,cl) filemy: 7 k-(cl,cl)-Pheny?		<b>.</b>	cvclo-Propyl			2-Pyridyl			0	S	
2,4-(C 2,4-(C	2,4-(ci,ci)-ricilyi 2,4-(ci,ci)-Phenvl		: <b>I</b>	cyclo-Propyl			Ethyl			0	S	
2, + 12			I	cvclo-Propyl			iso-Propyl			0	S	
1 Kualul-7	ınyı		:	71								

5	× 00000	-
15		
20	R5 Butyl tertButyl Phenyl 4-F-Phenyl	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
25		
35 .	cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl	i fdo L
40	m	, choice
45		
	2-Thienyl 2-Thienyl 3-Pyridyl 3-Pyridyl	3-Pyr1ay 1

Die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la' und lb' bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen. Öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen la und Ib eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen. Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin-und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpoly glykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,1 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen la und lb können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

45

50

- I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.003 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.
- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.010 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Richnusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtstellen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.004 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280 C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch

Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.003 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.004 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.010 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtstellen eines parafflnischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 2 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel in einer großen Zahl von Kulturplfanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und ib mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazlne, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen la und Ib allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalziösungen, welche zur Behebung von Ernährungs-und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

### Synthesebeispiele

45

5

10

15

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den nachstehenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

50

1. Verfahren zur Herstellung der Vorprodukte

### Beispiel 1.1

55

4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure

Zu 33,8 g (0,15 mol) 2-Methyl-oxazol-4,5-dicarbonsäureester in 300 ml Ethanol tropfte man bei -10 °C unter N<sub>2</sub> innerhalb von 4 h eine Lösung von 6,0 g (0,15 mol) Natriumhydroxid in 150 ml Wasser und rührte 2 h bei -10 °C nach. Man engte die Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte mit Salzsäure auf pH = 8 bis 9 ein und extrahierte zweimal mit je 300 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit konz. HCl auf pH = 2 an und extrahierte die wäßrige Phase viermal mit je 250 ml Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Man erhielt 26,4 g (88 %) 4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure als weißen Feststoff (Isomerenverhältnis: 3:1 (¹H-NMR, HPLC). Zu isomerenreiner 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure gelangte man durch fraktionierte Kristallisation aus Cyclohexan/ Ethylacetat 2:1 oder Säulenchromatographie an Kieselgel (Lösungsmittel: Toluol, THF, Eisessig (7:3:1). ¹H-NMR (250 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO); Hauptisomer: δ = 1,28 (t; 3H), 2,52 (s; 3H), 4,30 (q; 2H), 14,00 (bs; 1H).

### Beispiel 1.2

15

# 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure

Eine Lösung von 7,00 g (25 mmol) 2-Methylthio-thiazol-4,5-dicarbonsäurediethylester in 100 ml
Ethanol/Wasser (2:1) wurde bei Raumtemperatur innerhalb von einer Stunde mit einer Lösung von 1,10 g
(27,5 mmol) Natriumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt. Man rührte eine Stunde nach, entfernte dann das
Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 100 ml Wasser auf, extrahierte einmal mit 50
ml Diethylether und säuerte die wäßrige Phase mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt
wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 4,50 g (73 %). Schmelzpunkt: 104 °C.

Die in der folgenden Tabelle genannten Carbonsäuren wurden gemäß dem vorstehenden Beispiel erhalten:

	Beisp.	R¹	R <sup>5</sup>	Х	phys. Daten
30	1.9(b)	Phenyl	CH₃	S	Fp.: 127-137
	1.4(a)	n-Butylthio	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	s	0,95 (t;3H), 1,40 (t;3H), 1,50(sext;2H), 1,80 (quint;2H), 3,40 (t;2H), 4,35 (q;2H)
35	1.5(b)	n-Butylthio	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	s	0,95 (t;3H), 1,35 (t;3H), 1,50 (sect;2H), 1,80 (quint;2H), 3,30 (t;2H), 4,45 (q;2H)
35	2.6(b)	iso-Propylthio	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	s	1,50 (d;6H), 1,45 (t;3H), 3,90 (hept;1H), 4,55 (q;2H), 12,50 (s;1H)
	1.7(a)	iso-Propylthio	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	s	1,45 (t;3H), 1,50 (d;6H), 4,05 (hept;1H), 4,50 (q;2H), 12,50 (s;1H)
40	1.8(a)	Methylthio	CH₃	s	2,80 (s;3H), 4,05 (s;3H)

### Beispiel 1.9

## 2-Methylthiothiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester

Eine Lösung von 9,2 g (0,03 mol) 2-Chlor-thiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester in 30 ml Ethanol wurde bei 0°C tropfenweise mit einer Lösung von 2,1 g (0,03 mol) Natrium-methylthiolat in 10 ml Ethanol versetzt. Man ließ das Gemisch auf 25°C erwärmen und rührte zwei Stunden nach. Danach entfernte man das Lösungsmittel bei vermindertem Druck, nahm den Rückstand in 100 ml Diethylether auf und wusch nacheinander mit je 50 ml 5 %iger Natronlauge und Wasser. Man trocknete über Natriumsulfat, engte ein und behielt 7,2 g (87 %) Produkt als farbloses Öl zurück.

1H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 250 MHz, TMS als intermer Standard): 1,35 (t, J=7,0 Hz, 3H), 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75

(s, 3H), 4.30 (q, J = 7.0 Hz; 2H), 4.50 (q, J = 7.0 Hz; 2H).

### 2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Vla und Vlb

Beispiel 2.1

10

25

30

### 2-Methoxythiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid

Eine Lösung von 12,00 g (46 mmol) 2-Brom-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Methanol wurde bei 25 °C mit 8,90 g einer 30 %igen Lösung (49 mmol) von Natriummethanolat in Methanol versetzt. Man hielt das Gemisch vier Stunden unter Rückfluß auf Siedetemperatur, engte dann die klare Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Diethylether auf, filtrierte und entfernte das Lösungsmittel bei vermindertem Druck. Man erhielt 9,60 g (98 %) Produkt als gelbes Öl. ¹H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (s; 9H), 4,10 (s; 3H), 7,00 (s, breit, 1H), 7,48 (s; 1H).

Beispiel 2.2

## 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid

Zu einer Lösung von 31,0 g (0,20 mol) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure in 200 ml Toluol und 2 ml Dimethylformamid tropfte man bei Raumtemperatur 47,6 g (0,40 mol) Thionylchlorid und rührte 1 h bei 80 °C. Man zog die Solventien im Vakuum ab, löste den Rückstand in 300 ml Dichlormethan und tropfte bei 0 bis 10 °C 24,0 g (0,42 mol) Cyclopropylamin in 20 ml Dichlormethan zu. Man rührte 12 h bei Raumtemperatur, gab 150 ml Wasser zu, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Man erhielt 37,2 g (96 %) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid.  $^1$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 250 MHz):  $\Delta$  = 0,62 (m; 2H), 0,88 (m; 2H), 1,34 (d; 6H), 2,86 (m; 1H), 3,09 (m; 1H), 6,93 (bs; 1H; NH), 8,09 (s; 1H).

Die in der folgenden Tabelle genannten Amide wurden gemäß den vorstehenden Beispielen oder analog der zitierten Literatur erhalten:

45

40

50

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5
Z.	R1		æ 33	R.		×	phys. Daten [Fp. (°C);	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (0 in ppm)]	in ppm)]	
2.3(a)	Phenylthio	•	I	tertButyl		v	1,50 (s;9H), 7,65 (m;2H),	1,50 (s;9H), 7,00 (s;1H) 7,65 (m;2H), 7,85 (s;1H)	7,00 (s;1H), 7,45 (m;3H), 7,85 (s;1H)	5 (m;3H),
2.4(a)	Brom		I	tertButyl		s	64-67			
2.5(a)	Phenyl		Ŧ	4-Cl-Phenyl		S	223			
2.6(a)	Brom		I	cyclo-Propyl		S	83-88			
2.7(a)	Methoxy		I	cyclo-Propyl		S	62-65			
2.8(a)	Methyl		I	tertButyl		S	1,48 (s	1,48 (s;9H), 2,72 (s;3H),	(s;3H),	
	•						7, 25 (s	;1H,NH), 7	, 91 (s;1H)	
. 2.9(a)	Phenyl		I	tertButyl		S	1,50 (s	;9н), 7,40	1,50 (s;9H), 7,40 (s;1H,NH),	
	•						7, 40-7,	90 (m;5H),	7,40-7,90 (m;5H), 8,03 (s;1H)	•
2.10(b)	Methoxy		I	tertButyl		S	126-129			
2.11(a)	Methyl		Ŧ	tertButyl		0	60- 63			
2.12(a)	cvclo-Propyl	l vac	I	tertButyl		0	72- 74			
2 13(a)	Fthv	2	I	tertButyl		0	1,36 (t	;3H), 1,48	(t;3H), 1,48 (s;9H), 2,80 (q;2H),	10 (q;2H),
(5)(1)							6, 78 (s	;1H, NH),	(s;1H, NH), 8,01 (s;1H)	
2,14(a)	Ethvl		I	cyclo-Propyl		0	50- 55			
2.15(a)	Ethvl		I	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl		0	40- 43			
2.16(a)	iso-Propy	~ <b>~</b>	I	tertButyl		0	1,36 (d	1;6Н), 1,48	1,36 (d;6H), 1,48 (s;9H), 3,06 (m;1H),	)6 (m;1H),
							6, 78 (s	;1H,NH), 8	6,78 (s;1H,NH), 8,00 (s;1H)	
(e)21 c	iso-Pronvl		I	cyclo-Propyl		0	0,58-0,	, (н; ш) 96	0,58-0,96(m;4H), 1,34(d;6H),	2,86 (m;
(B) / 1 · 7				•			1H), 3,	3,08 (m;1H),	(S;1H,NH),	8,09 (s;1н)
2,18(a)	iso-Propyl	٨	Ξ	iso-Propyl		0	38- 41			
2.19(a)	cvclo-Propy	opvl	I	iso-Propyl		0	27- 60	_		
2 20(a)	rvrlo-Probyl	opvl	Ξ	cyclo-Propyl		0	80-83	<b>m</b>		
2.20(a)	cyclo-propyl	י לאסי ואססי	Ξ	4-C1-Phenyl		0	147-150	0		
7.21(0)	רארוטויג	1640	:							

																		;3H), S:1H)			t;2H),		3,95 (s;2H),		s;1H),	
5																	<del>•</del>	s) 4 (s	•	Ŧ	30 (	Ŧ	95 (		, 20 (	
10	ð in ppm)]															0 (s;3H),	, 7,90 (s;1H)	5 (t;2H), 3,4 (s;3H), 5 (s:1H), 7,95 (s:1H)		, 7,92 (s;1н)	0 (t;2H), 3,30 (t;2H),	, 7,90 (s;1н)	(s;3H),	0 (s;1H)	16 (s;9н), 7,20 (s;1н),	
15	. Daten (°C); NMR (0 in ppm)]	1	90- 93	74	<b>76</b>	129	114	<b>79</b>	. 85	98	93	66 - 26	9	7	105-106	1,48 (s;9H), 4,30	7,15-7,42 (m;6H),	3 (s;9H), 3,25 5 (t:2H), 7.25		1,13-7,48 (m;4H),	1,48 (s;9H), 3,10	7,10-7,50 (m;6H),	3 (s;9H), 2,16	(s;1H), 8,00	3,86 (з;9н), 3,86	5 (s;1H)
20	phys. [Fp. (		-06	-89	-06	127-129	109-114	63-	82-	82-	on.	-76	100	102	105	1,48	7,15	1,48	1,48	7,13	1,48	7, 10	. 1,48	7, 20	1,50	7,45
25	*		0	0	0	0	S	S	S	S	S	S	S	S	S	v		v	S		S		s		S	
30				•	lų	lyl	ıyı	_	_	_	_		ıyı	_	=	=		۲,	_		۱,		۲,		۲	•
35	<b>R</b> 4		tertButy	iso-propyl	cyclo-Propyl	3-CF <sub>3</sub> -Pheny	cyclo-Propyl	tertButy	<b>Cyanomethy</b>	tertButy	tertButy	tertButy	Cyano-methy	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButv		tertButy]		tertButyl		tertButy	
40	R3		I	I	I	<b>エ</b>	I	Ξ	I	I	I	I	I	I	I	I		I	I	•	x	:	I		I	
45			Phenyl	Phenyl	Phenyl	Phenyl	Methyl	p-F-Benzyl	2, 6-C1, C1-Benzy1	tertButyl	2-Pyridyl	3-CF <sub>3</sub> -Benzyl	2-Phenyl-ethyl	4-C1-Phenoxy-methyl	2, 6-Cl, Cl-Benzyl	Benzvl		2-Methoxy-ethyl	2 4-Cl Cl-Renzvl		2-Phenvl-ethvl		Methyl-thiomethyl	,	tertButyl	
50	8		뮵	된	룹	<b>ā</b> .	Æ	۵	. ~	*	-5	က်	5-	4	2,	ă		5								
55	Nr.		2.22(a)	2.23(a)	2.24(a)	2.25(a)	2.26(a)	2.27(a)	2.28(a)	2.29(a)	2.30(a)	2.31(a)	2.32(a)	2.33(a)	2.34(a)	2.35(a)		2.36(a)	7 37(3)	(p) / C · 7	7 38(2)	(a) oc - 7	7 39(2)	(5) 65.7	2,40(a)	(2) 24 - 7

55	45 50	40	35	30	25	20	15	10	5	
Nr.		R3	<b>3</b>		×	phys. Daten [Fp. (°C);	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (8 in ppm)]	in ppm)]		
2.41(a)	Methoxymethyl	x	tertButyl		v	1,49 (	s;9H), 3,52 s;1H), 8,04	1,49 (s;9H), 3,52 (s;3H), 4,7 (s; 2H), 7,10 (s;1H), 8,04 (s;1H)	7 (s; 2н	<u>;</u>
2.42(a)	l-Phenyl-ethyl	I	tertButyl		v	1,48 ( 7,15–7	s;9H), 1,76 ,43 (m;6H),	1,48 (s;9H), 1,76 (d;2H), 4,43 (q; 1H), 7,15-7,43 (m;6H), 7,93 (s;1H)	43 (q; 1 )	E,
2.43(a)	cyclo-Hexyl	I	cyclo-Propyl	-	0	88- 91	-			
2.44(a)	cyclo-Hexyl	I	tertButyl		<b>o</b>	<b>76- 50</b>				
2.45(a)	n-Propyl	I	tertButyl		0	1,00 (	1,00 (t;3H), 1,44 2,74 (t;2H), 6,79	1,44 (s;9H), 1,81 (m; 2H), 6,75 (bs;1H),NH),	81 (m; 2 ),	É.
						8.05 (s;1H)				
2.46(a)	n-Propyl	I	cyclo-Propyl	ı,	0	54- 57	57			
2.47(a)	n-Propyl	I	2, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Phenyl	-Phenyl	0	L4 -44	14			
2.48(a)	4-Cl-Phenyl	I	cyclo-Propyl	r.	0	164-166	991			
(a)67.2	4-C1-Phenyl		tertButyl	_	0	131-133	133			
2.50(a)	4-C1-Phenyl	Ι	iso-Propyl		0	101-105	105			
2.51(a)	4-C1-Phenyl	Ξ	4-Cl-Phenyl	-	0	165-168	891			
2.52(a)	Methoxymethyl	I	tertButyl	_	0	1,46	(s;9H), 3,5	1,46 (s;9H), 3,50 (s;3H), 4,50 (s;2H),	50 (s;2t	÷
						6,80	(bs;1H,NH),	6,80 (bs;14,NH), 8,12 (s;1H)		
2.53(a)	tertButvl	I	tertButyl		0	83-	87			
2.55(a)	tertButyl	I	cyclo-Propyl	y J	0	78-	80			
2 55(a)	tertButyl	Ι	CH(cyclo-Propyl) 2CH3	ropyl) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	132-134	134			
2.55(a) 2.56(a)	Methoxymethyl	Ξ	cyclo-Propyl	yl	0	0, 60-	(H5'W) 06'0	0,60-0,90 (m;4H), 2,88 (m;1H),	<u>,</u>	
(3)00:3			•			3,44	3,44 (s;3H), 4,53 (s;2H),	3,44 (s;3H), 4,53 (s;2H),		
						φ¢ '0	(DS;1H, NH),	1m1;c) 12,8		

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib

Beispiel 1

5

4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 10,4 g (0,054 mol) 2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäurecyclopropylamid in 250 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70° C 0,12 mol n-Butyllithium (80,0 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO<sub>2</sub> und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 200 ml Wasser und 30 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 200 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 10,4 g (81 %) 4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 109 bis 112 °C. (Wirkstoffbeispiel 3.007).

Beispiel 2

25

40

45

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 8,00 g (37 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml
Tetrahydrofuran tropfte man bei -70 °C 65 ml einer 1,5 m Lösung (97 mmol) von n-Butyllithium in n-Hexan
und rührte 30 Minuten bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g
festes Kohlendioxid und ließ innerhalb von 14 Stunden auf Raumtemperatur erwärmen. Man entfernte das
Lösungsmittel im Vakuum, nahm den Rückstand in einer Mischung aus 150 ml Wasser und 16 ml 2 m
Natronlauge auf, filtrierte, säuerte das Filtrat mit konzentrierter Salzsäure an und saugte die ausgefallene
Carbonsäure ab.

Man erhielt 7,80 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxythiazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Fp.: 120 bis 122 °C. (Wirkstoffbeispiel 1.003).

Beispiel 3

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsäure

Zu einer Lösung von 5,4 g (25,2 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70 °C 56 mmol n-Butyllithium (37,3 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO<sub>2</sub> und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 150 ml Wasser und 10 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 50 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 100 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 3,9 g (60 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 105 bis 110° C.

(Wirkstoffbeispiel 2.001)

Beispiel 4

# a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid

Zu 12,2 g (61,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyi-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure tropfte man bei 0°C 40 ml Thionylchlorid und 1 ml Dimethylformamid und erhitzte 1 h unter Rückfluß. Man zog das überschüssige Thionylchlorid im Vakuum ab und destillierte den Rückstand im Ölpumpenvakuum.

Man erhielt 10,9 g (82 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid als gelbes Öl vom Sdp. 103 bis 105 $^{\circ}$  C/0,1 Torr. <sup>1</sup>H-NMR (250 MHz, CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  = 1,42 (t; 3H), 2,66 (s; 3H), 4,66 (q; 2H).

# 10 b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

Zu 10,9 g (50,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid in 150 ml Dichlormethan tropfte man bei 0°C eine Lösung von 11,0 g (150 mmol) tert.-Butylamin in 20 ml Dichlormethan und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man nahm das Reaktionsgemisch in 200 ml Wasser auf, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum am Rotationsverdampfer ab.

Man erhielt 11,9 g (93 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid als weißen Feststoff vom Smp. 152 bis 155° C.

(Wirkstoffbeispiel 4.001).

### Beispiel 5

25

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure

Zu 7,4 g (29,1 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Ethanol und 50 ml THF tropfte man bei 0°C unter N<sub>2</sub> eine Lösung von 1,2 g (30,0 mmol) Natriumhydroxid in 50 ml Wasser. Man rührte 2 h bei 20°C, zog die Solventien am Rotationsverdampfer im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte auf pH = 9 ein und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit je 100 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit 6N HCl auf pH = 2 an und extrahierte viermal mit je 150 ml Dichlormethan. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 6,1 g (93 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure als weißen Feststoff vom Smp. 186 bis 188 °C. (Wirkstoffbeispiel 4.002).

### 40 Beispiel 6

35

50

a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid

3,40 g (13,7 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure wurden in 50 ml Thionylchlorid gelöst und bis zur Beendigung der Gasentwicklung zum Rückfluß erhitzt. Man entfernte überschüssiges Thionylchlorid im Vakuum und behielt 3,55 g (98 %) Säurechlorid als farbloses Öl zurück.

1H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,50 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75 (s; 3H), 4,60 (q, J = 7,0 Hz; 2H).

# b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

3,50 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid wurden in 20 ml Dichlormethan gelöst und bei 0°C zu einer Lösung von 3,20 g (44 mmol) tert.-Butylamin in 50 ml Dichlormethan getropft. Man ließ das Gemisch auf Raumtemperatur erwärmen, rührte 14 Stunden nach und gab dann 100 ml 10 %ige Salzsäure zu. Die organische Phase wurde abgetrennt, mit 50 ml Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Man entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und behielt

4,00 g (100 %) Produkt als gelben Kristallbrei zurück.

¹H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 1,45 (s; 9H), 2,75 (s; 3H), 4,50 (q, J=7,0 Hz; 2H), 9,90 (s, breit; 1H).

(Wirkstoffbeispiel 2.007)

5

Beispiel 7

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methylthio-thiazol-4-carbonsäure

4,00 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid wurden in 50 ml Wasser/Ethanol (2:1) gelöst, mit 0,82 g (14,6 mmol) Kaliumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt und zwei Stunden zum Rückfluß erhitzt. Anschließend entfernte man das Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 50 ml Wasser auf und säuerte mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 3,40 g (94 %); Schmelzpunkt: 100 °C. (Wirkstoffbeispiel 2.005).

20 Beispiel 8

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,1 g (12,0 mmol) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure und 1,2 g (16,4 mmol) Acetonoxim in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei Raumtemperatur 4,4 g (43,6 mmol) 4-Methylmorpholin sowie 1,5 g (12,3 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und rührte 5 min. Anschließend fügte man 10,1 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 15,9 mmol) zu und erhitzte 7 h unter Rückfluß. Man engte ein, nahm den Rückstand in 100 ml Ethylacetat auf, extrahierte zweimal mit gesättigter Nariumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %lger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 3,1 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester als weißes Pulver vom Smp. 128 bis 131 °C. (Wirkstoffbeispiel 1.011).

35

25

Beispiel 9

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,80 g (16,8 mmol) 5-tert.-Butylamino-carbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure und 1,23 g (16,8 mmol) Acetonoxim in 40 ml Tetrahydrofuran tropfte man bei Raumtemperatur 3,46 g (16,8 mmol) Dicyclohexylcarbodiimid in 20 ml Tetrahydrofuran. Man rührte 14 h, saugte den ausgefallenen Niederschlag ab, zog das Solvens im Vakuum ab und chromatographierte den Rückstand an Kieselgel (Lösungsmittel: Cyclohexan:Ethylacetat (1:1)). Man erhielt 2,7 g (57 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyloxazol-4-carbonsäure-acetonoximester als weißen Feststoff vom Smp. 107 bis 111 °C. (Wirkstoffbeispiel 4.003).

Die in den folgenden Tabellen aufgeführten Wirkstoffe wurden analog zu den voranstehenden Verbindungen hergestellt.

		1																
5		ppm) ]						7,55 (m; 3H),	s; 1Н),		7,50 (d; 2H),	s; 1н),						
10		4R (8 in						, 7,55 (	, 7, 90 (	_	, 7,50 (	8,85 (	_					
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	141-144	138-142	120-122	146-148	194-195	1,50 (s; 9H),	7,75 (m, 2H),	16.60 (s; 1H)	1,50 (s; 9н),	7,65 (d, 2H)	16,50 (s; 1H)	137	101-107	128-131	128-131	
20		>	0	0	0	0	0	0			0			0	0	0	c	
25	<b>ም</b> ታህ	RS	x	I	I	r	I	Ŧ			I			r	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH1),	2 (CHJ) J=N-	7 /5 11.2 2 -41-
30	2 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1		tertButyl	cyclo-Propyl	tertButyl	lo-Propyl	tertButyl	tertButyl			tertButyl			tertButyl	tertButyl	lo-Propvl	tont _Buty]	ניים ביי
35	- \	λ 4	ter	cyc	ter	cyc	ter	ter			ter			ter	ter	7 7 7	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	נפ
40		R 3	I	I	Ξ	I	I	I	•		io H			I	<b>=</b>	: =	= =	Ξ
45		R1	Methyl	Methyl	Methoxv	Methoxy	Phenyl	Phenylthio	•		4-Cl-Phenylthio	•		Methylthio	Methyl	To the second	Methoxy	Methoxy
50		Beispiel Nr.	1.001	1 .002	1,003	1.004	1.005	1.006			1.007	•		1 008	000	600.1	010.1	1.011

5		m)]	2H), 3H), 1H),																	
10		Daten (°C); NMR (¢ in ppm)]	0,89 (m; 2,12 (s; 2,94 (m;																	
16		phys. Daten [Fp. (°C);	0,66 (m; 2H), 2,10 (s, 3H), 2,77 (s; 3H), 8,23 (s; 1H)	143-146	11	26	93	76	100	100-102	109-110	128	132	142	148-150		150-153	158-161	162-164	
20		>	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0		0	0	0	
<b>25</b>		R5	-N=C (CH3) 2	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	I	I	×	I	I	I	I	I	Ŧ	I		I	I	I	
30		R4	cyclo-Propyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	tertButyl	
35		<b>&amp;</b>	3	+	-	•	~	_	_	٠.	-		_	_					•	
40		R 3	I	I	I	I	I	I	I	yl H	I	I	I	I	I		I	yl H	<b>=</b>	
45	Tabelle 1 (Fortsetzung)	R1	Methyl	Phenyl	n-Butyl-S-	iso-Propyl-S-	4-F-Benzyl	2-Phenyl-ethyl	Methoxy-methyl	2, 4-Cl, Cl-Benzyl	3-CF <sub>3</sub> -Benzyl	Benzyl	tertButyl	cyclo-Propyl	4-C1-Phenoxy-	methyl	iso-Propyl	4-Phenoxy-pheny l	3, 4, 5-Trimeth-	oxy-benzyl
50	Tabelle 1 (	Beispiel Nr.	12	1.013	1.014	1.015	1.016			1.019	1.020	1.021	1.022	1.023	1.024		1.025	1.026	1.027	

5		-				1H),	5 (m;3H),
10		in ppm)]				1,51 (s;9H), 1,78 (d;2H), 4,40 (q;1H), 7,16-7,45 (m;5H), 8,00 (s;1H),	16-80 (s;1H) 1,50 (s;9H), 4,61 (s;2H), 7,25-7,45 (m;3H), 7,95 (s;1H), 16-70 (s;1H)
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]				(s;9H), 1,78 5-7,45 (m;5H), 8	16-80 (s;1H) 1,50 (s;9H), 4,61 7,95 (s;1H), 16-70
20		(Fp	201	199	147	1,51	16-8 1, 50 7, 95
25			0	0	0	<b>o</b> .	
30		R5	· <b>=</b>	S.	I	<b>x</b>	x
35		84	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
40		R 3	I	I	I	I	H
<b>45</b>	Tabelle 1 (Fortsetzung)	R1	2-Pyridyl	4-F-Benzyl	I	1-Phenyl-ethyl	2,6-Cl,Cl-Benzyl H
55	Tabelle 1	Beispiel Nr.	1.028	1.029	1.030	1.031	1.032

5 10			phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	10						1,45 (t,3H); 2,75 (s,3H); 4,5 (q,2H), 9.9 (s.1H)		1,45 (s,9H); 1,50 (d,6H); 3,80 ("sept.",1H);	10,0 (s, 1n)		90:		•	171	
20			phys. [Fp.	105-110	120	136	167	100	75-77	1,45	81	1,45	o' 0	ž	105-106	115	,	171-071	143
25			>	0	0	0	0	0	0	<b>.</b>	0	0	(	0	0	0	•	<b>o</b>	0
30		### F =\ =\ =\ =\	R5	Ŧ	I	Methyl	I	I	I	Ethyl	I	I		I	x	Ŧ		I	r
35	0=		<b>4</b>	tertButyl	tertButyl	4-C1-Phenyl	4-Cl-Phenyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	tertButyl	,	tertButyl	tertButyl
40			R 3	r	I	I	I	Ŧ	I	I	I	I		I	I	I		I	I
<b>45</b>			R1	Methoxy	Phenyl	Phenyl	Pheny 1	Methy1thio	4-Cl-Phenylthio	SCH <sub>3</sub>	n-Butvl-S-	iso-Propyl-S-		cyclo-Propyl	iso-Propyl	3,4,5-Trimeth-	oxy-benzyl	Methoxy-methyl	tertButyl
55	Tabelle 2		Beispiel	2.001	. 2.002	2.003	2.004	2.005	2.006	2.007	2 008	2.009		2.010	2.011	2.012		2.013	2.014

55	45 50	40	35 <sub>.</sub>	30	· 25	5 10 15	
Tabelle 2	Tabelle 2 (Fortsetzung)						
Beispiel Nr.	R1	R 3	<b>4</b>	RS	>	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	
410 6	[0.200]	<b>.</b>	tertButv]	Ethy 1	0	152-156	
2.016	cyclo-Propyl	: <b>I</b>	tertButyl	Ethyl	0	0,95-1,08 (m,;2H), 1,15-1,28 (m;2H), 1,45 (t;3H), 1,45 (s;9H), 2,28-2,42 (m;1H)	, (m;1H)
						4,45 (q;2H), 9,92 (s;1H)	
2.017	Methoxy-methyl	I	tertButyl	I	0	1,45 (s;9H), 3,55 (s;3H), 4,75 (s;2H), 9,18-9,65 (s;1H), 9,98 (s;1H),	H)
2.018	Methoxy-methyl	I	tertButyl	Ethyl	0	1,42 (t;3H), 1,45 (s;9H), 3,50 (s;3H), 4,50 (q;2H), 4,75 (s;2H), 9,95 (s;1H)	Ĕ Ŧ
2.019	4-F-Benzyl	I	tertButyl	<b>x</b>	0	1,45 (s;9H), 4,30 (s;2H), 6,95-7,15 (m;2H) 7,20-7,35 (m;2H), 9,95 (s;1H)	(m;2H)

5																					
10			Daten (°C); NMR (ø in ppm)]																		
15			phys. Daten [Fp. (°C); NMR	152-157	30-131	35-138	169-172	117	151-153	09-112	64-70	107-109	87-90	118-120	121-125	62-65	62-92	101-104	.48-151	.03-106	126-129
20			4 5	7.	Ξ	=	16	Ξ	ä	Ξ	9	Ξ.	<b>∞</b>		-	9	7	Ξ	À	=	_
			>	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
25 30			R5	I	I	I	I	I	I		I	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH3)2	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I			
35		N 1 N 1 N 1 N 1 N 1 N 1 N 1 N 1 N 1 N 1	R4	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-propyl	tertButyl	iso-Propyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl
40			R 3	I	I	I	Ξ	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	Ξ	I
45			R1	Methyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propy1	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl
50 55	Tabelle 3		Beispiel Nr.	3.001	3.002	3.003	3.004	3.005	3.006	3.007	3.008	3.009	3.010	3.011	3.012	3.013	3.014	3.015	3.016	3.017	3.018

5								, (11,14)	2,01 (E;1H), 8,46 (bs;1H,NH)															
10		in ppm)]																						
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (å in ppm)]						77 - 410	1,42 (d;6H), 1,44 (S;9H), 3,18 (m;1H), 5,00 (d;2H),	:														
20		phys. Daten [Fp. (°C);	108-110	213-215	103-106	93-95	107-110		1,42 (d;0H), 3,18 (m;1H),	203-206	144-146	217-218	137-139	126-128	149-154	160-164	121-125	117-119	119-122	137-139	108-110	69-72	120-123	142-145
25		-	0	0	0	0	0	•	>	0	0	0	0 -	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
30		25	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	I	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C (cyclo-	Propy1)2	CH 2−C≡CH	I	I	I	4-CH <sub>3</sub> 0-Phenyl	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	-N=C (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	I
35	·	R4	cyclo-Propyl	4-Cl-Phenyl	iso-Propyl	iso-Propyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl	tertButyl	4-Cl-Phenyl	tertButyl	cyclo-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	2, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -
40		R3	x	I	I	I	Ŧ		I	Ŧ	I	I	=	Ŧ	I	Ŧ	<b>=</b>	Ŧ	I	Ŧ	I	I	I	I
45 50	Tabelle 3 (Fortsetzung)	R1	cyclo-Propyl		Ethyl	Ethyl	Ethyl		iso-Propyl	Phenyl	Phenyl	Phenyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl	Phenyl	Pheny 1	cyclo-Hexyl	cyclo-Hexyl	cyclo-Hexyl	Phenyl	n-Propyl	n-Propy1	n-Propyl	n-Propyl
55	Tabelle 3	Beispiel Nr.	3.019	3.020	3.021	3.022	3.023		3.024	3.025	3.026	3.027	3.028	3.029	3.030	3.031	3.032	3.033	3.034	3.035	3.036	3.037	3.038	3.039

5						
10		(ø in ppm)]				
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ð in ppm)]	104-109 176-178 132-134	114-118	125-128 123-126	124-127
20		١	000		0 0	0
25		R5	· • • • • •	,	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N=C (CH3) 2
30				_		l fo
35 <sub>.</sub>		R4	tertButyl tertButyl	-CH-CH <sub>3</sub>	tertButyl	-CH-CH <sub>3</sub>   cyclo-Propy <sup>]</sup>
40		R3	<b>=</b> = =	: <b>:</b>	ΙI	I
45	Tabelle 3 (Fortsetzung)	18	Methoxymethyl tertButyl	tertButyl	tertButyl tertButyl	tertButyl
50	belle 3	Beispiel Nr.	3.040	3.043	3.044 3.045	3.046
65	Ta	Be i		ก์ ค้	ന്ന്	ന

·			
5		ppm)]	
10		NMR (6 in	
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	152-155 186-188 107-111 155-166 230-232.
20		>	00000
25	\$\$. \$.	25	Ethyl H -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ethyl H
30			<pre>tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl</pre>
35		₹ *	t t t t
40		R3	
45		. R1	Methyl Methyl Methyl Phenyl
50	Tabelle 4	Beispiel Nr.	4.001 4.002 4.003 4.004 4.005

Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zwecke der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S.

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10-25°C bzw. 20-35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Lateinischer Name	Deutscher Name
Cassia tora Chenopodium album Chrysanthemum coronarium Ipomoea spp. Triticum aestivum Veronica spp.	Gumüse-Kassie Weißer Gänsefuß Kronenwucherblume Prunkwindearten Sommerweizen Ehrenpreisarten

30

35

5

10

15

20

25

Mit 1,0 kg/ha a.S. im Nachauflaufverfahren eingesetzt, lassen sich mit den Beispielen 1.001, 1.003, 1.004, 1.009, 1.010, 1.011, 3,002, 3,005 und 3,024 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen. Verbindungen 1.001, 1.003 und 1.009 zeigen gleichzeitig Kulturpflanzenverträglichkeit an Weizen. Verbindung 3.005 wird sehr gut von der Kulturpflanze Mais toleriert.

### **Ansprüche**

### 1. Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

45

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio oder Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen; C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio; Phenoxy oder Phenylthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring eln oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxycarbonyl;
  - Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano, R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR<sup>5</sup>;
- 15 Y Sauerstoff oder Schwefel;
  - R5 Wasserstoff;
- 20 C<sub>3</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste Ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen;
  - Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenal-kyl, Halogen, Nitro und Cyano;
- 25 C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl;
  - Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;
  - C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und Cyano;
  - einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;
  - Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
- ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium;
  - einen Rest -N =  $CR^6R^7$ ;
  - $R^6$ ,  $R^7$  Wasserstoff;  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel - $(CH_2)_m$  mit m=4 bis 7 Kettengliedern;
- R<sup>3</sup> Wasserstoff; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder Di-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylamino;
  - $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann:  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Halogen und  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl;
  - R<sup>4</sup> Hydroxy; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, Halogen, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio;
- C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano;
  - C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen;
  - Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-

Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkanoyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann, oder

F3 und R4 gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CO-bliden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

2. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und Ib nach Anspruch 1, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.

3. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb nach Anspruch 1, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ Wasserstoff; C₁-C₄-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkylthio;

R<sup>2</sup> einen Rest -COYR<sup>5</sup>;

R<sup>5</sup> Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido oder ein Rest -N = R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>

R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> Wasserstoff; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern,

R3 Wasserstoff und

25

30

35

40

50

R<sup>4</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl.

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen  $R^2$   $CO_2R^5$  und  $R^5$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Diester der Formel II

in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zu einem Gemisch der Monoester Illa und Illb

hydrolysiert und Illa und Illb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin der Formel IV

amidiert.

Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und ib gemäß Anspruch 1, in denen X Schwefel und R<sup>2</sup>
 CO<sub>2</sub>H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V

in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formel IV gemäß Anspruch 4 zu den Isomeren la und Ib umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbonsäure der Formel IIIc bzw. IIId

in an sich bekannter Weise zunächst gemäß Anspruch 4 aktiviert und amidiert und das so erhaltene Amid Vla bzw. Vlb

anschließend in Gegenwart einer Base mit einem Carboxylierungs- oder einem Formylierungsreagens umsetzt.

- 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen  $R^2$   $CO_2H$  bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid la bzw. Ib in dem  $R^2$   $CO_2R^5$  und  $R^5$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl bedeutet in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert.
- 8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen  $R^2$  COYR<sup>5</sup> bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb ( $R^2$  =  $CO_2H$ ) gemäß Anspruch 4 aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII  $HYR^5$  VII
- o umsetzt.

5

15

20

25

30

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen  $R^2$  4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb ( $R^2 = CO_2H$ ,  $CO_2R'$ ;  $R' = C_1-C_4-Alkyl$ ) in an sich bekannter Weise mit 2-Aminoethanol VIII

umsetzt.

10. Herbizides Mittel, enthaltend neben inerten Zusatzstoffen mindestens ein Oxazol- bzw. Thiazolcarbon-50 säureamid der Formel la bzw. Ib

in der die Substituenten die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, und X Schwefel bedeuten kann, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> und R³ Wasserstoff bedeutet, oder wenn R¹ Thien-2-yl, YR⁵ Hydroxy, R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

- 11. Herbizides Mittel nach Anspruch 10, enthaltend neben mindestens einem Oxazol- bzw. Thiazolcarbon-säureamid der Formel la bzw. Ib und inerten Zusatzstoffen weitere wirksame Bestandteile.
- 12. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die unerwünschten Pflanzen und/oder die von unerwünschten Pflanzenwuchs freizuhaltende Fläche mit einer herbizid wirksamen Menge eines Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids der Formel la bzw. Ib behandelt.